

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
7. November 2002 (07.11.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 02/088126 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **C07D 487/04**,  
A01N 43/90

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/04287

(22) Internationales Anmeldedatum:  
18. April 2002 (18.04.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
101 21 162.7 30. April 2001 (30.04.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): **BAYER AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE];  
51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **GEBAUER, Olaf**  
[DE/DE]; Jesuitengasse 111, 50737 Köln (DE). **GREUL,**  
**Jörg, Nico** [DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Le-  
ichlingen (DE). **HEINEMANN, Ulrich** [DE/DE]; Am  
Sonnenhang 1, 42799 Leichlingen (DE). **ELBE, Hans,**  
**Ludwig** [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE).  
**KRÜGER, Bernd, Wieland** [DE/DE]; Am Vorend  
52, 51467 Bergisch Gladbach (DE). **MAURER, Fritz**  
[DE/DE]; Brahmstr. 36, 40789 Monheim (DE). **DUNKEL,**  
**Ralf** [DE/DE]; Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE).  
**VOERSTE, Arnd** [DE/DE]; Salierring 33, 50677 Köln  
(DE). **EBBERT, Ronald** [DE/DE]; Hitdorfer Str. 305,

51371 Leverkusen (DE). **WACHENDORFF-NEU-**  
**MANN, Ulrike** [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566  
Neuwied (DE). **KITAGAWA, Yoshinori** [JP/JP]; P.O. Box  
157, Tokyo, Tokyo 103-91 (JP). **MAULER-MACHNIK,**  
**Astrid** [DE/DE]; Neuenkamper Weg 48, 42799 Leichlin-  
gen (DE). **KUCK, Karl, Heinz** [DE/DE]; Pastor-Löh-Str.  
30a, 40764 Langenfeld (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER AKTIENGE-**  
**SELLSCHAFT**; 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,  
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),  
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,  
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

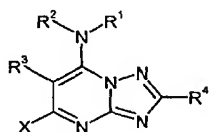
**Erklärung gemäß Regel 4.17:**

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu  
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die  
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,

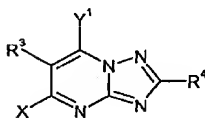
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: TRIAZOLOPYRIMIDINES

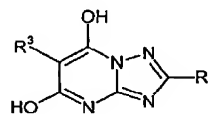
(54) Bezeichnung: TRIAZOLOPYRIMIDINE



(I)



(II)



(V)

(57) **Abstract:** The invention relates to novel triazolopyrimidines of formula (I), wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> and X have the meanings as cited in the description. The invention also relates to a plurality of methods for producing said novel substances and the uses thereof for combating undesired micro-organisms, novel intermediate products of formulae (II), (V) and a method for the production thereof, as well as novel amines and carbamates which have the formula as cited in the description and a method for the production thereof.

(57) **Zusammenfassung:** Neue Triazolopyrimidine der Formel (I), in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Neue Zwischenprodukte der Formeln (II), (V) sowie Verfahren zu deren Herstellung. Außerdem auch neue Amine und Carbamate der in der Beschreibung angegebenen Formeln sowie Verfahren zu deren Herstellung.



WO 02/088126 A1



CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

**Veröffentlicht:**

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

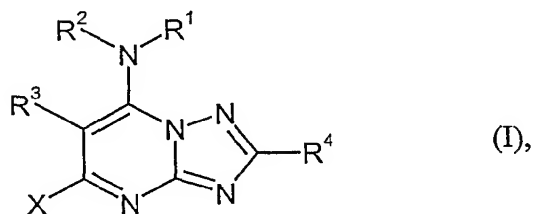
- 1 -

Triazolopyrimidine

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidine, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen. Die Erfindung betrifft außerdem neue Zwischenprodukte sowie Verfahren zu deren Herstellung.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. EP-A 0 550 113, WO 94-20 501, EP-A 0 613 900, US-A 5 612 345, EP-A 0 834 513, WO 98-46 607 und WO 98-46 608). Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

R<sup>1</sup> für Amino, Hydroxy, für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkinyloxy, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Dialkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkenylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkynylamino, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkylamino, gegebenenfalls substituiertes N-

- 2 -

Cycloalkyl-N-alkyl-amino, gegebenenfalls substituiertes Alkylidenamino, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl oder für einen Rest der Formel -S-R<sup>5</sup> steht, worin

5           R<sup>5</sup>   für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

10           R<sup>2</sup>   für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

oder

15           R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen,

            R<sup>3</sup>   für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

20           R<sup>4</sup>   für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht und

            X    für Halogen steht,

25           sowie Säure-Additionssalze von denjenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

            R<sup>1</sup>   für Amino steht,

gefunden.

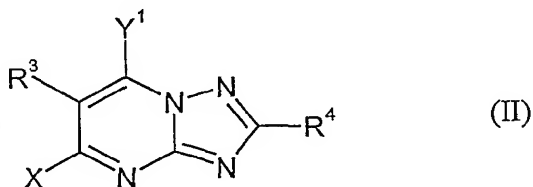


- 3 -

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können je nach Substitutionsmuster gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z.B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Ist R<sup>3</sup> an beiden Atomen, die der Bindungsstelle benachbart sind, ungleich substituiert, können die betreffenden Verbindungen in einer besonderen Form der Stereoisometrie, als Atropisomere, vorliegen.

Weiterhin wurde gefunden, dass sich Triazolopyrimidine der Formel (I) herstellen lassen, indem man

a) Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel

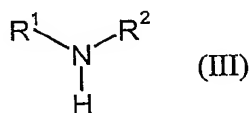


in welcher

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y<sup>1</sup> für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



in welcher

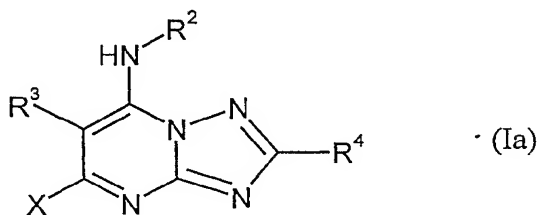
R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- 4 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt,

5 oder

b) Triazolopyrimidine der Formel



10 in welcher

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Sulfensäurehalogeniden der Formel

15



in welcher

$R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und

20

$Y^2$  für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umgesetzt,

25

und gegebenenfalls an die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in denen

- 5 -

R<sup>1</sup> für Amino steht,

eine Säure addiert.

5

Schließlich wurde gefunden, dass sich die neuen Triazolopyrimidine der Formel (I) bzw. deren Säureadditions-Salze sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide Wirksamkeit und lassen sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwenden.

10

Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine der Formel (I) eine wesentlich bessere mikrobizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Stoffe gleicher Wirkungsrichtung.

15

R<sup>1</sup> steht bevorzugt für Hydroxy, Amino, für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Amino, Phenyl, Heterocyclyl, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Dialkylamino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen, Halogenycycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Oxo, Hydroxyimino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

20

25

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkynyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

- 6 -

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Halogenalkyl mit 1 bis 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkoxy mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

10

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinyloxy mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

15

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyloxy mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen,

20

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Dialkylamino mit 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in jedem der Alkylreste,

25

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkynylamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

- 7 -

für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes N-Alkyl-N-Alkenylamino mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkylteil und 2 bis 6 Kohlenstoffatomen im Alkenylteil,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkylamino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen,

10 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und 1 bis 7 Kohlenstoffatomen in Alkylteil,

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkylidenamino mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

15 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Phenyl,

für gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Heterocyclyl mit 5 oder 6 Ringgliedern,

20 für gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Heterocycloxy mit 5 oder 6 Ringgliedern,

für -SR<sup>5</sup>, worin

25 R<sup>5</sup> für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen,

- 8 -

für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Alkinyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen oder

10 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl, Cyano, Phenyl und/oder Heterocyclyl substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen steht,

wobei die zuvor genannten Heterocyclyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

15 Halogen, Hydroxy, Phenyl, 1,2-Dioxyethylen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkoxy mit 1 oder 2  
20 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen, Halogenalkylthio mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen und 1 bis 5 Halogenatomen und wobei die zuvor genannten Heterocyclylreste gesättigt oder teilweise ungesättigt sind,

25 und wobei die zuvor genannten Phenyl-Reste einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

30

- 9 -

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

5           jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

10           jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15           jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

20           jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

25           in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylenedioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-), 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen.

30

- 10 -

R<sup>2</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff,

5 für gegebenenfalls durch Halogen, Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen  
Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoff-  
atomen, Oxo, Hydroximino und/oder Alkoximino mit 1 bis 4 Kohlenstoff-  
atomen substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

10 für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlen-  
stoffatomen substituiertes Alkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen,

für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlen-  
stoffatomen substituiertes Alkynyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen oder

15 für gegebenenfalls durch Halogen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlen-  
stoffatomen substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden  
sind, für einen 3- bis 6-gliedrigen heterocyclischen Ring, der gesättigt oder  
teilweise gesättigt ist, der neben dem bereits erwähnten Stickstoffatom noch  
20 ein weiteres Heteroatom aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel  
enthalten kann und der einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden  
substituiert sein kann durch

Halogen, Hydroxy, Cyano, Morpholinyl, Amino, einen annelierten Phenyl-  
ring, eine Methylen- oder Ethylenbrücke,

25 Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder  
verschiedenen Halogenatomen;

Alkylcarbonalamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,

Dialkylamino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen,

30 Alkoxycarbonylamino mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,



- 11 -

Di(alkoxycarbonyl)amino mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen,  
Hydroxyalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen,  
Alkoxycarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder  
Alkylcarbonyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

5

R<sup>3</sup> steht bevorzugt für Phenyl, das einfach bis vierfach, gleichartig oder  
verschieden substituiert sein kann durch

10

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thio-  
carbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkyl-  
sulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

15

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2  
bis 6 Kohlenstoffatomen;

20

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halo-  
genalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1  
bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogen-  
atomen;

25

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyl-  
oxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder ver-  
schieden Halogenatomen;

30

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkyl-  
carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximi-  
noalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den  
einzelnen Alkylteilen;

- 12 -

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen,

in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy  
(-O-CH<sub>2</sub>-O-), 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach  
oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch  
Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1  
bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogen-  
atomen.

10

R<sup>4</sup> steht bevorzugt für gegebenenfalls durch 1 bis 9 Halogenatome substituiertes  
Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder für gegebenenfalls durch 1 bis 9  
Halogenatome substituiertes Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

15

X steht bevorzugt für Fluor, Chlor oder Brom.

20

R<sup>1</sup> steht besonders bevorzugt für Hydroxy, Amino, für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-  
Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthio-  
methyl, 2-Methylthio-ethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Ace-  
tylmethyl, 2-Hydroximino-propyl, 2-Methoximino-propyl, Allyl, 2-Methyl-  
prop-2-enyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(Trifluormethyl)-ethyl, 3,3,3-  
Trifluorpropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl,

25

Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Difluor-  
methoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy,

30

Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butyl-  
amino, Dimethylamino, Diethylamino, Trifluorethylamino, Cyclohexylme-  
thylamino, 2-Cyanethylamino, Allylamino, 1-Cyclopropylethylamino, Cyclo-  
propylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino, 1-Me-

- 13 -

thylethylidenamino, Phenyl, Benzyloxy, Piperidinyl, Morpholinyl, Pyridylmethoxy, Thiazolylmethoxy, oder für  $-S-R^5$ , worin

5  $R^5$  für Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Difluormethyl, Difluorchloromethyl, Dichlorfluormethyl oder Trifluormethyl steht,

oder

10  $R^1$  steht für (2,2-Dichlorcyclopropyl)methyl, (2-Furyl)methyl, (2-Tetrahydrofuryl)methyl, (2-Tetrahydropyranyl)methyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,3-Dioxolan-2-ylmethyl, 1-Cyclopropylethyl, 1-Cyclopropylethylamino, 1-Methylethylidenamino, 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl, 2,4-Dichlorbenzyloxy, 2,6-Dichlorbenzyloxy, 2-Butyl, 2-Chlorbenzyloxy, 2-Fluorcyclopropyl, 2-Hexahydropyran-2-yl, 2-Methoxyethyl, 2-Thienylmethyl, 2-Tolyl, 2-Trifluoromethylcyclohexyl, 3-(Dimethylamino)-propyl, 3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl, 3,5-Dichlorbenzyloxy, 3-Aminopropyl, 3-Chlorbenzyloxy, 3-Tolyl, 3-Trifluormethylbenzyloxy, 3-Trifluormethylcyclohexyl, 3,5-(Bis-trifluormethyl)-cyclohexyl, 2-Trifluormethyl-cyclohexyl, 4-Trifluormethyl-cyclohexyl, 4-Chlorbenzyloxy, 4-Fluorbenzyloxy, 4-Fluorphenyl, 4-Tolyl, 4-Trifluormethylbenzyloxy, 4-Trifluormethylcyclohexyl, Allyl, Allylamino, Allyloxy, Benzyloxy,  $-C(CH_3)_2-CF_3$ ,  $-C(CH_3)_2-CH_2-COCH_3$ ,  $-C_2H_5$ ,  $-CH(CH_2OH)-COOCH_3$ ,  $-CH(CH_3)-C(CH_3)_3$ ,  $-CH(CH_3)-CH(O-CH_3)_2$ ,  $-CH(CH_3)-CH=CH_2$ ,  $-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)_2$ ,  $-CH(CH_3)-CH_2-O-CH_3$ ,  $-CH(CH_3)-CH_2-OH$ ,  $-CH(CH_3)-COOCH_3$ ,  $-CH(CH_3)-COO-t-butyl$ ,  $-CH_2-C(CH_3)=CH_2$ ,  $-CH_2-C(CH_3)_3$ ,  $-CH_2-CF_3$ ,  $-CH_2-CH(OCH_3)_2$ ,  $-CH_2-CH_2-CF_3$ ,  $-CH_2-CH_2-Cl$ ,  $-CH_2-CH_2-CN$ ,  $-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$ ,  $-CH_2-CH_2-N(CH_3)_2$ ,  $-CH_2-CH_2-NH_2$ ,  $-CH_2-CHF_2$ ,  $-CH_2-CN$ ,  $-CH_2-COOC_2H_5$ ,  $-CH_2-COOC_2H_5$ ,  $-CH_2-COOCH_3$ ,  $-CH_3$ , Cyclohexyl, Cyclopentyl, Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Dimethylamino, i-Butoxy, i-Butyl, i-Propylamino, n-Butoxy, n-Butyl, n-Butylamino,  $-NH_2$ ,  $-NH-CH_2-CF_2-CHF_2$ ,  $-NH-CH_2-$

15

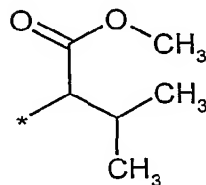
20

25

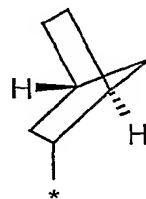
30

- 14 -

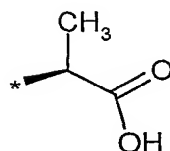
CF<sub>3</sub>, -NH-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, -O-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, -O-CH<sub>3</sub>, -OH, O-i-Propyl, Propargyl, t-Butoxy, t-Butyl, t-Butylamino, oder für eine Gruppierung



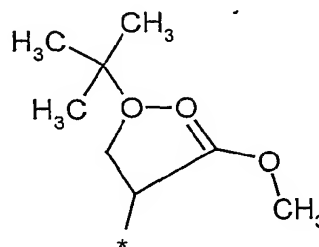
AB3



AB30



AB33



AB5

5

(\* markiert jeweils die Bindungsstelle)

10

wobei die zuvor genannten Thiazolyl- und Pyridyl-Reste im Falle von Thiazolyl einfach oder zweifach und im Falle von Pyridyl einfach bis dreifach, jeweils gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Dichlorfluormethylthio, Trifluormethylthio und/oder Phenyl,

15

- 15 -

und wobei die zuvor genannten Phenyl- und Benzyloxy-Reste im Phenylteil einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch

5 Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, 10 Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, 15 Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-), 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, 20 gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl.

R<sup>2</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxymethyl, 2-Methoxy-ethyl, Methylthiomethyl, 2-Methylthio-ethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Acetylmethyl, 2-Hydroxyimino-propyl, 2-Methoxyimino-propyl, Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(1,1,1-Trifluormethyl)ethyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl. 25

- 16 -

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen besonders bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an welches sie gebunden sind, für 1-Pyrrolinyl, 3-Pyrrolinyl, Pyrrolidinyl, Dihydropyridinyl, Piperidinyl, Pyrazolinyl, Pyrazolidinyl, Imidazolinyl, Imidiazolidinyl, 1,2-Diazinan-yl, 1,3-Diazinan-yl, Piperazinyl, Oxazolinyl, Oxazolidinyl, Isoxazolyl, Isoxazolidinyl, Dihydrooxazinyl, Morpholinyl, Thiazolinyl, Thiazolidinyl, Thiomorpholinyl, wobei die genannten Heterocyclen substituiert sein können durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxa, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinomethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinomethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, durch einen annelierten Phenylring oder durch eine Methandiyl- oder Ethandiyl-Brücke.

R<sup>3</sup> steht besonders bevorzugt für Phenyl, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl,

- 17 -

Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-), 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl.

R<sup>4</sup> steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl oder Cyclopropyl.

X steht besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen ganz besonders bevorzugt gemeinsam für eine der folgenden Gruppierungen

-CH(CF<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH(CF<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,

-CH(CH<sub>3</sub>)-CH=CH-CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-,

-CH(COOCH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-,

-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-O-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH(NH<sub>2</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-

CH<sub>2</sub>-C-CH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-

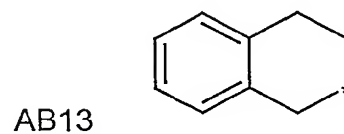
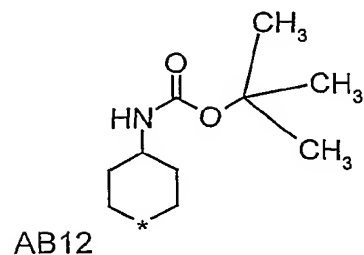
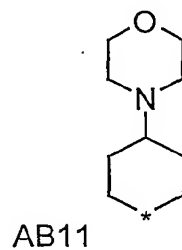
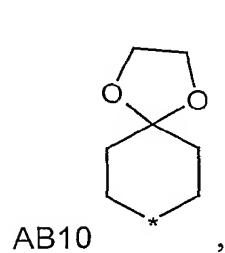
-CH<sub>2</sub>-CH=C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-

-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(CF<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-

- 18 -

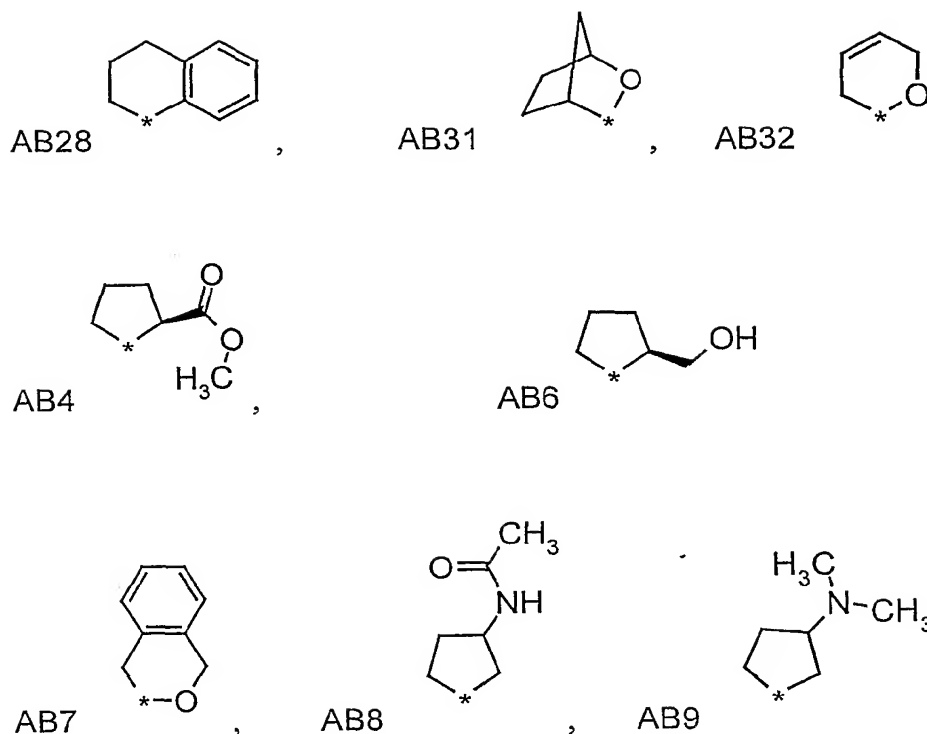
-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(COCH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(COOCH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(NH-COCH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH=C(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH=CH-CH<sub>2</sub>-  
 5 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CHBr-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CHF-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-  
 -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-  
 10 -CH<sub>2</sub>-S-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -NH-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-  
 -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,

oder für eine der folgenden Gruppierungen, in denen X<sub>2</sub> für das Stickstoffatom steht, an welches die Reste R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> gebunden sind





- 19 -



(\* markiert jeweils die Bindungsstelle)

10  $R^2$  steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-, i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl.

15  $R^3$  steht ganz besonders bevorzugt für Phenyl, welches einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor und/oder Chlor in den Positionen 2, 4 und 6 substituiert ist.

X steht ganz besonders bevorzugt für Chlor.

- 20 -

Ganz besonders bevorzugt sind weiterhin diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> und X die zuvor genannten bevorzugten Bedeutungen haben und

R<sup>3</sup> für 2,4-disubstituiertes, 2,6-disubstituiertes oder 2,4,6-trisubstituiertes Phenyl steht.

5

Ganz besonders bevorzugt sind weiterhin diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> und X die zuvor genannten Bedeutungen haben und

R<sup>3</sup> für 2-Chlor-4-fluorphenyl, 2-Chlor-6-fluorphenyl oder 2-Chlor-4,6-difluorphenyl steht.

10

Ganz besonders bevorzugt sind weiterhin diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und X die zuvor genannten Bedeutungen haben und

R<sup>4</sup> für Cyclopropyl steht.

15

Ganz besonders bevorzugt sind weiterhin diejenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

X, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die zuvor genannten Bedeutungen haben und

R<sup>1</sup> für Wasserstoff und

R<sup>2</sup> für -CH(CH<sub>3</sub>)CF<sub>3</sub> steht.

20

Eine weitere ganz besonders bevorzugte Gruppe von Verbindungen sind diejenigen Triazolopyrimidine der Formel (I), in denen

25

R<sup>4</sup> für Cyclopropyl steht und

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und X die zuvor als bevorzugt genannten Bedeutungen haben.

30

- 21 -

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Bedeutungen entfallen.

5 Bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen sind auch Additionsprodukte aus Säuren und denjenigen Triazolopyrimidinen der Formel (I), in denen

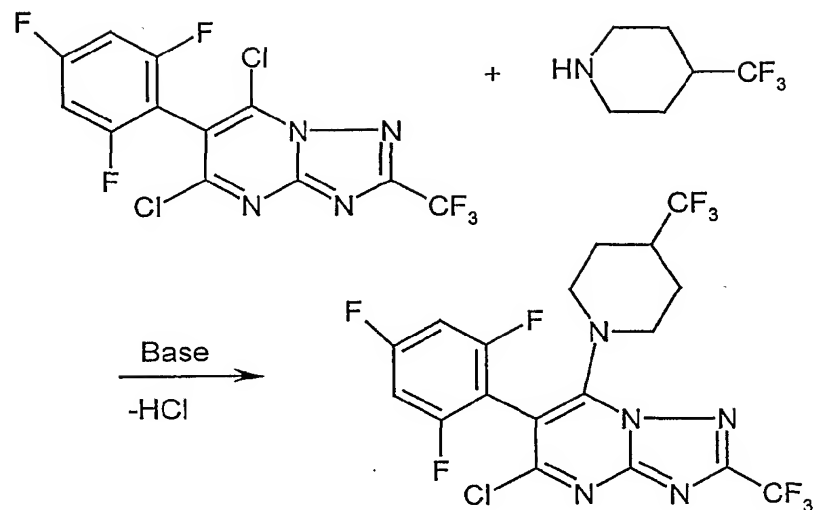
R<sup>1</sup> für Amino steht und

10 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X diejenigen Bedeutungen haben, die für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

15 Zu den Säuren, die addiert werden können, gehören vorzugsweise Halogenwasserstoffsäuren, wie z.B. die Chlorwasserstoffsäure und die Bromwasserstoffsäure, insbesondere die Chlorwasserstoffsäure, ferner Phosphorsäure, Salpetersäure, mono- und bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren, wie z.B. Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure und Milchsäure, sowie Sulfonsäuren, wie z.B. p-Toluolsulfonsäure, 1,5-Naphthalindisulfonsäure, Saccharin und Thiosaccharin.

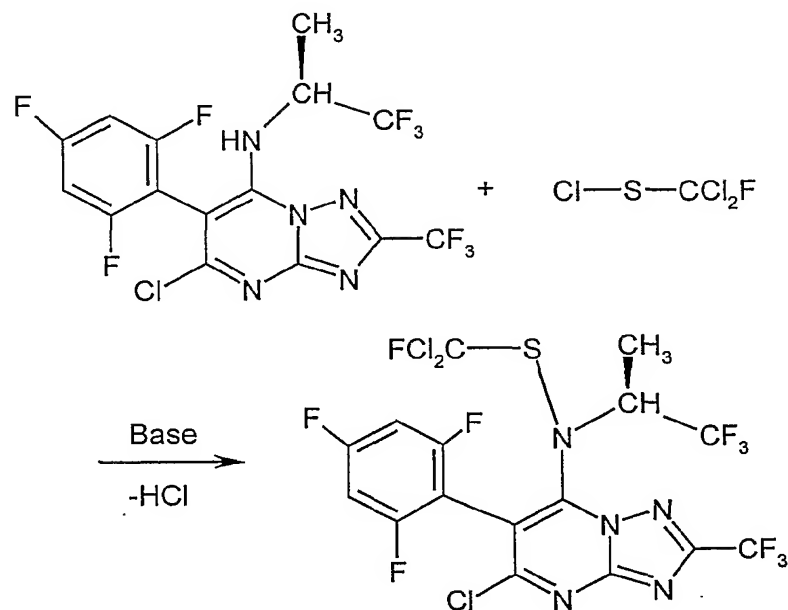
20 Verwendet man 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo[1,5-a]-pyrimidin und 4-Trifluormethylpiperidin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

- 22 -



Verwendet man 5-Chlor-2-(trifluormethyl)-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-methyl-ethyl]-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]-triazolo-[1,5-a]pyrimidin-7-amin und Dichlorfluor-

5 methan-sulfenylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsge-  
mäßigen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



10

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Dihalogen-triazolo-pyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein defi-

- 23 -

niert. In dieser Formel haben  $R^3$ ,  $R^4$  und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.  $Y^1$  steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

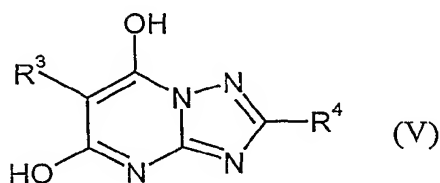
5

Die Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II) sind neu. Auch diese Stoffe eignen sich zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Die Dihalogen-triazolopyrimidine lassen sich herstellen, indem man

10

c) Dihydroxy-triazolo-pyrimidine der Formel



in welcher

15

$R^3$  und  $R^4$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

20

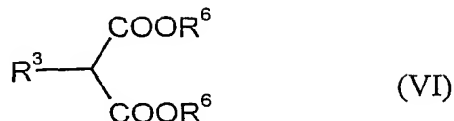
Die bei der Durchführung des Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Dihydroxy-triazolopyrimidine sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^3$  und  $R^4$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

25

Auch die Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel (V) sind bisher noch nicht bekannt. Sie lassen sich herstellen, indem man

- 24 -

d) Arylmalonester der Formel



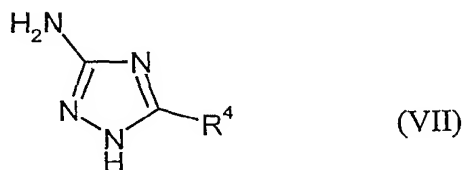
5 in welcher

$\text{R}^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und

$\text{R}^6$  für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

10

mit Aminotriazolen der Formel



in welcher

15

$\text{R}^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in  
Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt.

20

Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Arylmalonester sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel hat  $\text{R}^3$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.  $\text{R}^6$  steht vorzugsweise für Methyl oder Ethyl.

25

- 25 -

Die Arylmalonester der Formel (VI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen (vgl. US-A 6 156 925).

5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (d) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Aminotriazole sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel hat  $R^4$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.

10 Die Aminotriazole der Formel (VII) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vergl. J. Org. Chem. (1974), 39(11), Khim. Geterotsikl. Soedin. (1989), (2), 278 oder Zh. Obshch. Khim. (1969), 39(11)).

15 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, i-Propanol, n-Butanol und tert.-Butanol.

20 Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (d) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Tributylamin oder Pyridin. Im Überschuss eingesetztes Amin kann auch als Verdünnungsmittel fungieren.

25 Die Temperaturen können bei der Durchführung des Verfahrens (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 180°C.

30 Bei der Durchführung des Verfahrens (d) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist allerdings auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des Verfahrens (d) setzt man Arylmalonester der Formel (VI) und Aminotriazol der Formel (VII) im allgemeinen in äquivalenten Mengen um. Es ist aber auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem Überschuss zu verwenden. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Als Halogenierungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (c) alle für den Ersatz von Hydroxygruppen durch Halogen üblichen Komponenten in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Phosphortrichlorid, Phosphortribromid, Phosphor-  
pentachlorid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder deren Gemische. Die entsprechenden Fluor-Verbindungen der Formel (II) lassen sich aus den Chlor- oder Brom-Verbindungen durch Umsetzung mit Kaliumfluorid herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (c) alle für derartige Halogenierungen üblichen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol. Als Verdünnungsmittel kann aber auch das Halogenierungsmittel selbst, z.B. Phosphoroxychlorid oder ein Gemisch von Halogenierungsmitteln fungieren.

Die Temperaturen können auch bei der Durchführung des Verfahrens (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Bei der Durchführung des Verfahrens (c) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des Verfahrens (d) setzt man Dihydroxy-triazolpyrimidin der Formel (V) im allgemeinen mit einem Überschuss an Halogenierungsmittel um. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

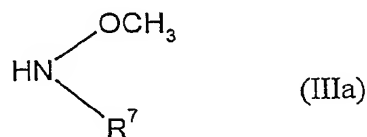


- 27 -

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^1$  und  $R^2$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für  $R^1$  und  $R^2$  als bevorzugt angegeben wurden.

Die Amine der Formel (III) sind teilweise bekannt.

Neu sind Amine der Formel (IIIa),

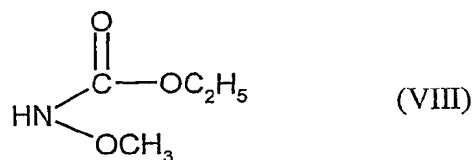


in welcher

$R^7$  für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für  $\text{---CH}_2\text{---C(CH}_3\text{)=CH}_2$  steht.

Die Amine der Formel (IIIa) lassen sich herstellen, indem man

e) in einer ersten Stufe N-Methoxycarbaminsäure-ethylester der Formel (VIII)



mit Halogenverbindungen der Formel (IX),



in welcher

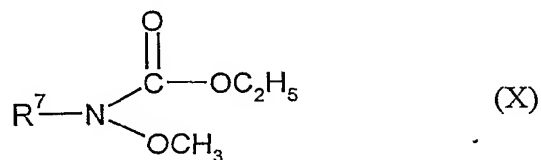
- 28 -

$R^7$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und

$X^1$  für Brom oder Iod steht,

5

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (X),



10

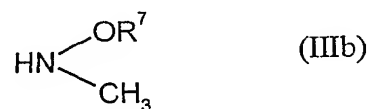
in welcher

$R^7$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

15

Neu sind auch Amine der Formel (IIIb),



20

in welcher

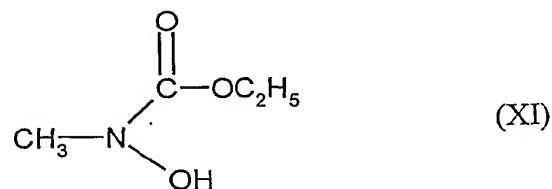
$R^7$  die oben angegebenen Bedeutungen hat.

Die Amine der Formel (IIIb) lassen sich herstellen, indem man

25

- 29 -

- f) in einer ersten Stufe N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XI),



5 mit Halogenverbindungen der Formel (IX),



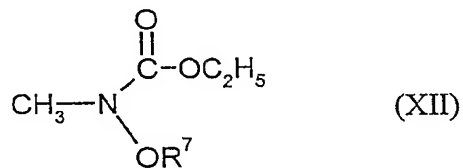
in welcher

10

$\text{R}^7$  und  $\text{X}^1$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (XII),

15



in welcher

$\text{R}^7$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

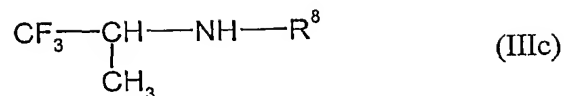
20

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

Neu sind auch Trifluorisopropylamine der Formel (IIIc),

25

- 30 -



in welcher

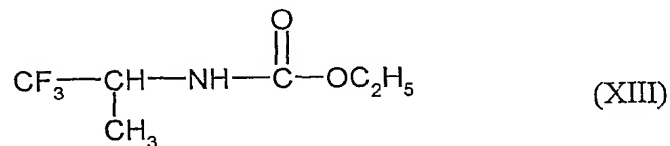
$\text{R}^8$  für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

5

Die Trifluorisopropylamine der Formel (IIIc) lassen sich herstellen, indem man

g) in einer ersten Stufe N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XIII),

10



mit Halogenverbindungen der Formel (XIV),



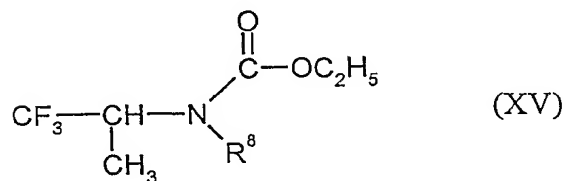
15

in welcher

$\text{R}^8$  und  $\text{X}^1$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (XV),



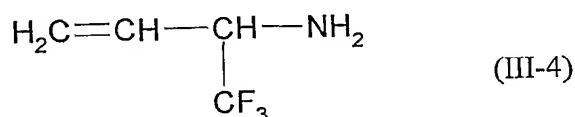
in welcher

- 31 -

R<sup>8</sup> die oben angegebenen Bedeutungen hat,

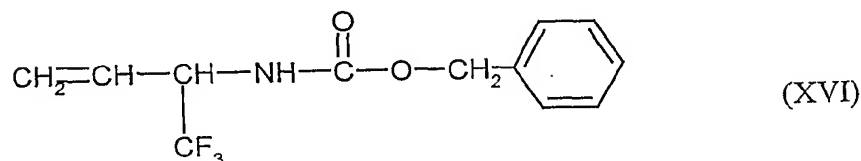
in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

Neu ist schließlich auch das 3-Trifluor-methyl-3-amino-propen der Formel (III-4)



Das 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel (III-4) lässt sich herstellen, indem man

h) das Carbamat der Formel (XVI)



mit wässriger Salzsäure umgesetzt.

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (e)-(g) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formeln (VIII), (IX), (XI), (XIII), (XIV) und (XVI) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) kommen jeweils alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Säureakzeptoren in Frage.

Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat. Als organische Basen seien genannt: tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononon (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) jeweils alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Ether, wie Diethylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid oder N-Methylpyrrolidon; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, tert.-Butanol, n-Butanol.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e) (f), und (g) jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 100°C.

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) arbeitet man im allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem Druck oder, sofern keine niedrig siedenden Komponenten an der Umsetzung beteiligt sind, unter vermindertem Druck zu arbeiten.

- 33 -

Bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) setzt man

- 5       • auf 1 mol an N-Methoxy-carbaminsäure-ethylester der Formel (VIII) im Allgemeinen 0,5 bis 1,5 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (IX) ein, bzw.
- 10       • auf 1 mol an N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XI) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (IX) ein, bzw.
- 15       • auf 1 mol an N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XIII) im Allgemeinen 0,5 bis 15 mol, vorzugsweise 1 bis 5 mol an Halogenverbindung der Formel (XIV) ein.

Die Aufarbeitung erfolgt jeweils nach üblichen Methoden, beispielsweise durch Extraktion und anschließende Trocknung oder durch Fällung mit anschließender Filtration und Trocknung. Gegebenenfalls noch vorhandene Verunreinigungen können nach üblichen Methoden entfernt werden.

Die bei der Durchführung der ersten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) als Zwischenprodukte erhaltenen Verbindungen der Formeln (X), (XII) und (XV) sind neu.

Auch bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) können die Reaktionstemperaturen jeweils innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 80°C.

30

Auch bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) arbeitet man im Allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist jedoch wiederum möglich, jeweils auch unter erhöhtem Druck oder, sofern die zu isolierenden Produkte keine sehr niedrigen Siedepunkte aufweisen, unter vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung der zweiten Stufe der erfindungsgemäßen Verfahren (e), (f) und (g) setzt man auf 1 mol an einer Verbindung der Formel (X), (XII) der (XV) jeweils bis zu 10 mol an Kaliumhydroxid ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Dabei werden die Amine zweckmäßigerweise im Allgemeinen durch Hinzufügen von Säure, vorzugsweise wässriger Salzsäure, in Form ihrer Salze isoliert.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) können die Reaktionstemperaturen ebenfalls in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 10°C und 150°C, vorzugsweise bei Rückflusstemperatur.

Im Allgemeinen arbeitet man bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, unter erhöhtem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) setzt man auf 1 mol an Carbat der Formel (XVI) einem Überschuss, vorzugsweise bis zu 10 mol an wässriger Salzsäure ein. Die Aufarbeitung erfolgt wiederum nach üblichen Methoden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Triazolopyrimidine sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die



bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.

5 Bei den Triazolopyrimidinen der Formel (Ia) handelt es sich um erfindungsgemäße Stoffe. Sie lassen sich nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) herstellen.

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Sulfensäurehalogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel hat R<sup>5</sup> vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits  
10 im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden. .

Y<sup>2</sup> steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Chlor.

15 Die Sulfensäurehalogenide der Formel (IV) sind bekannt oder lassen sich nach bekannten Methoden herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen, inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise  
20 verwendbar sind aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Dioxan, Tetrahydro-  
25 furan, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid oder N-Methylpyrrolidon; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

- 36 -

Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle für derartige Umsetzungen üblichen Säurebindemittel in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO),  
5 Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet  
10 man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

Sowohl bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als auch des Verfahrens (b) arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber  
15 auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck, im allgemeinen zwischen 0,1 und 10 bar, zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 mol an Dihalogen-triazolo-pyrimidin der Formel (II) im allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach  
20 üblichen Methoden.

Zur Herstellung von Säureadditions-Salzen von Triazolopyrimidinen der Formel (I) kommen vorzugsweise diejenigen Säuren in Frage, die bereits im Zusammenhang  
25 mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Säureadditions-Salze als bevorzugte Säuren genannt wurden.

Die Säureadditions-Salze der Verbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach üblichen Salzbildungsmethoden, z.B. durch Lösen einer Verbindung der  
30 Formel (I) in einem geeigneten inerten Lösungsmittel und Hinzufügen der Säure, z.B.

- 37 -

Chlorwasserstoffsäure, erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen Lösungsmittel gereinigt werden.

- 5 Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

- 10 Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

- 15 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- 20 Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

- 25 Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

- 30 Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder

- 38 -

*Pseudoperonospora cubensis*;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;

5      *Bremia*-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;

*Peronospora*-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;

*Erysiphe*-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;

10

*Sphaerotheca*-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;

*Podosphaera*-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;

15      *Venturia*-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;

*Pyrenophora*-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*  
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

20      *Cochliobolus*-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*  
(Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

*Uromyces*-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;

25      *Puccinia*-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;

*Sclerotinia*-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;

*Tilletia*-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;

30

- 39 -

- Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;
- Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;
- 5 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;
- Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;
- Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;
- 10 Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;
- Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;
- 15 Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;
- Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;
- Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise Pseudocercospora herpotrichoides.
- 20 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.
- 25 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

30

- 40 -

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum,  
5 innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen  
10 Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens. .

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

20 Mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen können Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können  
25 Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen  
30 Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden wer-

den, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

5

Die Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

10

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

15

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

20

25

- 42 -

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,

Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,

Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,

Coniophora, wie *Coniophora puetana*,

Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,

Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,

Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,

Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,

Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,

Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,

Escherichia, wie *Escherichia coli*,



Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,

*Staphylococcus*, wie *Staphylococcus aureus*.

5 Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

10

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, 20 welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diato-meenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminium-oxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. 30

- 44 -

gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

**Fungizide:**

- 5 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,
- Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,
- 10 Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram, Carpropamid,
- 15 Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- 20 Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,
- Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenciclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon,
- 25 Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Fenhexamid,
- 30 Guazatin,

- 46 -

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

5 Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat,  
Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan,  
Isovaledione, Iprovalicarb,

10 Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfer-  
naphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-  
Mischung,

15 Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl,  
Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax,  
Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

20 Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin,  
Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon,  
Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin,  
Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

25 Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen,

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine,

30 Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol,  
Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl,

- 47 -

Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol,  
Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

5

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

10      Dagger G,

OK-8705,

OK-8801,

15

$\alpha$ -(1,1-Dimethylethyl)- $\beta$ -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

$\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

$\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -methoxy-a-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

$\alpha$ -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- $\beta$ -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-

20

triazol-1-ethanol,

(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,

(E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,

1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,

1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,

25

1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,

1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,

1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,

1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,

1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,

30

1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,

- 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,  
 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,  
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,  
 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,  
 5 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,  
 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,  
 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,  
 2-Aminobutan,  
 10 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,  
 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,  
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,  
 2-Phenylphenol(OPP),  
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,  
 15 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,  
 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,  
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,  
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,  
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,  
 20 8-Hydroxychinolinsulfat,  
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,  
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,  
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,  
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-  
 25 hydrochlorid,  
 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,  
 Kaliumhydrogencarbonat,  
 Methantetrathiol-Natriumsalz,  
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,  
 30 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,

- 49 -

- Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,  
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,  
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,  
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,  
 5 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,  
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropanocarboxamid,  
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,  
 10 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  
 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,  
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,  
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,  
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiaazol-7-carbothioat,  
 15 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,  
 4-[3,4-Dimethoxyphenyl)-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

**Bakterizide:**

- 20 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,  
 Othilinin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam,  
 Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

- 25 Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,  
 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,  
 Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

- 50 -

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopftora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocycythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,

30



- 51 -

Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

Kernpolyederviren

5 Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,  
Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl,  
Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazon, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin,  
10 cin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M  
15

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phor-  
rat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Piri-  
miphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat,  
Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimi-  
20 difen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

Ribavirin  
25

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron,  
Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Theta-  
30 cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam

- 52 -

hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

5 Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

10

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

15

1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin

2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol

2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion

2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

20

3-Methylphenyl-propylcarbamat

4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol

4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon

25

4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon

4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon  
Bacillus thuringiensis strain EG-2348

Benzoesäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid

Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-  
30 ester

- [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid  
Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd  
Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat  
N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin  
5 N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-  
1-carboxamid  
N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N"-nitro-guanidin  
N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid  
N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid  
10 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat  
N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid  
3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-  
propoxy]-benzol
- 15 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit  
Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch  
sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimyko-  
20 tisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze,  
Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans,  
Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie  
Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophy-  
ton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die  
25 Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren myko-  
tischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus be-  
reiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritz-  
30 pulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die

- 54 -

Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können mit erfindungsgemäßen Wirkstoffen alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventio-

nelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

5 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder  
10 gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.  
15

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen  
20 Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer  
25 Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte  
30 herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kul-

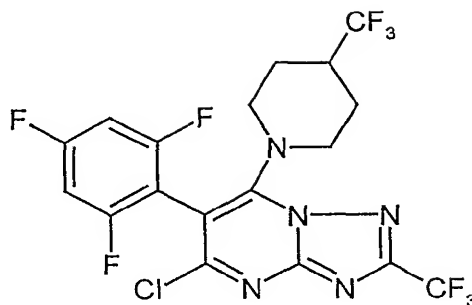
turpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende

- 57 -

Pflanzenarten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft mit den erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen.

Die Erfindung wird durch die folgenden Beispiele veranschaulicht.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

5

Verfahren (a)

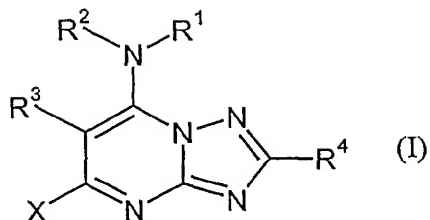
10 In eine Lösung von 0,7 g (181 mMol) 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin und 0,28 g (1,81 mMol) 4-Trifluormethylpiperidin in 20 ml Dichlormethan werden 0,18 g Triethylamin gegeben. Das Gemisch wird 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Danach wird das Reaktions-

15 Gemisch mit soviel 1N Salzsäure versetzt und gerührt, dass der pH-Wert der Mischung bei 1 - 2 liegt (ca. 50 ml). Die organische Phase wird abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Der Rückstand wird mit Petrolether verrührt und abgesaugt. Man erhält 0,3 g (30,3 % der Theorie) 5-Chlor-2-(trifluormethyl)-7-[4-(trifluormethyl)-1-piperidinyl]-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]-triazolo[1,5-a]pyrimidin.

20 HPLC: logP = 4,43

Nach den zuvor angegebenen Methoden werden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) erhalten.



**Tabelle 1**

| Bsp.<br>Nr. | $R^1$  | $R^2$                          | $R^3$                     | $R^4$                          | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|--------------------------------|----|-------------|------|-----------|
| 1           | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 4,43 |           |
| 2           | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,99 |           |
| 3           | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,94 |           |
| 4           | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,39 |           |
| 5           | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,06 |           |
| 6           | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,18 |           |
| 7           | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,76 |           |
| 8           | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,64 |           |
| 9           | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | t-Butyl                        | Cl |             | 4,24 |           |
| 10          | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 4,73 |           |
| 11          | -i-Propyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,8  |           |

- 60 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>                 | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|-----------------------|--------------------------------|----|-------------|------|-----------|
| 12          | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl                          | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,01 |           |
| 13          | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>                     | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,69 |           |
| 14          | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,83 |           |
| 15          | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 4,34 |           |
| 16          | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,76 |           |
| 17          | -i-Propyl   | -H                             | 2-Chlorophenyl        | Cyclopropyl                    | Cl |             | 3,39 |           |
| 18          | -CH <sub>2</sub> -CN                                  | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,02 |           |
| 19          | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl                          | -H                             | 2-Chlorophenyl        | Cyclopropyl                    | Cl | AS          | 3,59 |           |
| 20          | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl                          | -H                             | 2-Chlorophenyl        | Cyclopropyl                    | Cl | BS          | 3,61 |           |
| 21          | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,15 |           |
| 22          | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,82 |           |
| 23          | -CH <sub>2</sub> -CN                                  | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 2,27 |           |
| 24          | -CH <sub>2</sub> -CN                                  | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,91 |           |
| 25          | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl                          | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Br |             | 3,99 |           |

- 61 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>                 | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|---------------------------|--------------------------------|----|-------------|------|-----------|
| 26          | -i-Propyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,71 |           |
| 27          | -NH <sub>2</sub>  | -i-Propyl                      | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,77 |           |
| 28          | i-Propylamino   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,7  |           |
| 29          | 2-Methoxyethyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,93 |           |
| 30          | 2-Methoxyethyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,37 |           |
| 31          | 2-Methoxyethyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 4,04 |           |
| 32          | Cyclopentyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 4,25 |           |
| 33          | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 4,25 |           |
| 34          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,22 |           |
| 35          | Cyclopropyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,53 |           |
| 36          | -CH <sub>3</sub>  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             | 3,13 |           |
| 37          | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 38          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -   |                                | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 39          | -CH <sub>2</sub> -CN  | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |

- 62 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>                 | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|--------------------------------|----|-------------|------|-----------|
| 40          | Cyclopentyl  | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 41          | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 42          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 43          | 2-Methoxyethyl   | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 44          | -CH <sub>3</sub>   | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 45          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 46          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 47          | Cyclohexyl   | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 48          | Cyclopropylmethyl  | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 49          | i-Propylamino  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,05 |           |
| 50          | 1-Cyclopropylethylamino  | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 51          | n-Butylamino   | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 52          | -NH-CH <sub>2</sub> -CF <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>                                     | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |
| 53          | -NH-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                     | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl               | Cl |             |      |           |

- 63 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 54          | Allylamino   | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl | Cl |             |      |           |
| 55          | -NH-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl | Cl |             |      |           |
| 56          | i-Propylamino  | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl | Cl |             |      |           |
| 57          | t-Butylamino   | -H                             | 2-Chlorophenyl            | Cyclo-<br>propyl | Cl |             |      |           |
| 58          | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -            |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3    |           |
| 59          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,86 |           |
| 60          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,43 |           |
| 61          | n-Propyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,75 |           |
| 62          | Cyclopentyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,23 |           |
| 63          | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,23 |           |
| 64          | 2-Methoxyethyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,34 |           |
| 65          | Cyclopropyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,51 |           |
| 66          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,09 |           |
| 67          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,6  |           |

- 64 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>                 | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|--------------------------------|----|-------------|------|-----------|
| 68          | Cyclopropylmethyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,86 |           |
| 69          | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,04 |           |
| 70          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>                                     | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,85 |           |
| 71          | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -        |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,57 |           |
| 72          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,29 |           |
| 73          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,94 |           |
| 74          | n-Propyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,14 |           |
| 75          | Cyclopentyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,66 |           |
| 76          | -i-Propyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,15 |           |
| 77          | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,71 |           |
| 78          | 2-Methoxyethyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 2,68 |           |
| 79          | Cyclopropyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 2,85 |           |
| 80          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,53 |           |
| 81          | Cyclopropylmethyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,23 |           |

- 65 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>                 | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|------------------------|--------------------------------|----|-------------|------|-----------|
| 82          | -i-Propyl  | -H                             | 3-Chlor-4-fluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,01 |           |
| 83          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -                                 |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,2  |           |
| 84          | i-Propylamino  | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,68 |           |
| 85          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -                |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,57 |           |
| 86          | -CH <sub>3</sub>   | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,49 |           |
| 87          | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,44 |           |
| 88          | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,7  |           |
| 89          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,43 |           |
| 90          | -CH <sub>3</sub>   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,12 |           |
| 91          | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 2,78 |           |
| 92          | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 2,8  |           |
| 93          | -CH <sub>3</sub>   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 2,44 |           |
| 94          | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 4,27 |           |
| 95          | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | -CF <sub>3</sub>               | Cl |             | 4,69 | 123-25    |

- 66 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 96          | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,73 | 100-02    |
| 97          | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 3-Chlor-4-fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,32 |           |
| 98          | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                                |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,85 |           |
| 99          | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -               |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,15 |           |
| 100         | -CH <sub>3</sub>   | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,6  |           |
| 101         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -            |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,18 |           |
| 102         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,5  |           |
| 103         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,92 |           |
| 104         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,46 |           |
| 105         | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,37 |           |
| 106         | n-Propyl   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,82 |           |
| 107         | 2-Methoxyethyl   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,38 |           |
| 108         | -CH <sub>3</sub>   | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,17 |           |
| 109         | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,76 |           |



- 67 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>             | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|----------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 110         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,09 |           |
| 111         | Cyclopropylmethyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,89 |           |
| 112         | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,84 |           |
| 113         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,03 |           |
| 114         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-<br>Fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,91 |           |
| 115         | -CH(CH <sub>2</sub> OH)-COOCH <sub>3</sub>                              | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,93 |           |
| 116         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>                | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,64 |           |
| 117         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH-CH(CH <sub>3</sub> )-                       |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,52 |           |
| 118         | AB3   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,11 |           |
| 119         | AB4   |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,65 |           |
| 120         | AB5   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,47 |           |
| 121         | AB6   |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,13 |           |
| 122         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -OH                               | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,93 |           |
| 123         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH(O-CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,74 |           |

- 68 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>             | R <sup>4</sup>                 | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|----------------------------|--------------------------------|----|-------------|------|-----------|
| 124         | -CH(CH <sub>3</sub> )-COOCH <sub>3</sub>              | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,45 |           |
| 125         | -CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>                  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,13 |           |
| 126         | -CH(CH <sub>3</sub> )-COO-t-butyl                     | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,44 |           |
| 127         | -NH <sub>2</sub>                                      | i-Butyl                        | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | Cl |             | 3,47 | 176-78    |
| 128         | 2-Methoxyethyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,84 |           |
| 129         | -NH <sub>2</sub>                                      | i-Butyl                        | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,06 | Paste     |
| 130         | -NH <sub>2</sub>                                      | i-Butyl                        | 2-Chlor-6-<br>Fluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,12 | 157-8     |
| 131         | -NH <sub>2</sub>                                      | i-Butyl                        | 3-Chlor-4-<br>fluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,31 | 155-8     |
| 132         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl                          | -H                             | 2-Chlor-6-<br>Fluorophenyl | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,01 |           |
| 133         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl             | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,9  |           |
| 134         | 1,2-Dimethylpropyl                                    | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,37 |           |
| 135         | i-Butoxy  | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,88 |           |
| 136         | -O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 2,22 |           |
| 137         | 3-Chlorbenzyloxy                                      | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub>               | Cl |             | 3,21 |           |

- 69 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|------------------|-----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 138         | 4-Chlorbenzyloxy  | -H               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,23 |           |
| 139         | -O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>            | -H               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,78 |           |
| 140         | Allyloxy  | -H               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,38 |           |
| 141         | t-Butoxy  | -H               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,68 |           |
| 142         | 2-Hexahydropyranyloxy   | -H               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,54 |           |
| 143         | -O-CH <sub>3</sub>  | -CH <sub>3</sub> | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,54 |           |
| 144         | O-i-Propyl  | -H               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,46 |           |
| 145         | i-Butyl   | -H               | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,14 |           |
| 146         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                  | -H               | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,5  |           |
| 147         | 2-Butyl   | -H               | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,1  |           |
| 148         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -CH <sub>3</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,5  |           |
| 149         | Propargyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,77 |           |
| 150         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | -CH <sub>3</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,8  |           |
| 151         | 1,3-Dioxolan-2-ylmethyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,67 |           |

- 70 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 152         | Allyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,18 |           |
| 153         | (2-Furyl)methyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,22 |           |
| 154         | i-Butyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,63 |           |
| 155         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,55 |           |
| 156         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                        | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,59 |           |
| 157         | Allyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,5  |           |
| 158         | (2-Furyl)methyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,55 |           |
| 159         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,26 |           |
| 160         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,14 |           |
| 161         | n-Butyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,08 |           |
| 162         | Cyclopropylmethyl  | n-Propyl                       | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,08 |           |
| 163         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl  | n-Propyl                       | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,68 |           |
| 164         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )- |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,81 |           |
| 165         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,9  |           |

- 71 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 166         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,9  |           |
| 167         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,03 |           |
| 168         | AB7  |                                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,73 |           |
| 169         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -            |                                | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,84 |           |
| 170         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                                | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,61 |           |
| 171         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,17 |           |
| 172         | n-Propyl   | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,52 |           |
| 173         | Cyclopentyl  | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,97 |           |
| 174         | -i-Propyl  | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,52 |           |
| 175         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,98 |           |
| 176         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,2  |           |
| 177         | 2-Methoxyethyl   | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,12 |           |
| 178         | Cyclopropyl  | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,28 |           |
| 179         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,84 |           |

- 72 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|----------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 180         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,36 |           |
| 181         | Cyclopropylmethyl  | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,62 |           |
| 182         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,78 |           |
| 183         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,56 |           |
| 184         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,63 |           |
| 185         | 1-Cyclohexylethyl  | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4    |           |
| 186         | Cyclohexyl   | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,28 |           |
| 187         | 2-Butyl  | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,82 |           |
| 188         | 3-Trifluormethylcyclohexyl   | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,37 |           |
| 189         | 3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl   | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,62 |           |
| 190         | 4-Trifluormethylcyclohexyl   | -H             | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,39 |           |
| 191         | i-Butyl  | -H             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3    |           |
| 192         | n-Butyl  | -H             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,04 |           |
| 193         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>   | -H             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,4  |           |

- 73 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 194         | 2-Butyl   | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,01 |           |
| 195         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>    | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,76 |           |
| 196         | -i-Propyl   | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,69 |           |
| 197         | Cyclohexyl  | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,46 |           |
| 198         | 1-Cyclohexylethyl                                     | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,24 |           |
| 199         | Cyclopropyl   | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,45 |           |
| 200         | Cyclopropylmethyl                                     | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,77 |           |
| 201         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,72 |           |
| 202         | 1,3-Dioxolan-2-ylmethyl                               | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,56 |           |
| 203         | Allyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,06 |           |
| 204         | (2-Furyl)methyl                                       | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,1  |           |
| 205         | i-Butyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,49 |           |
| 206         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,41 |           |
| 207         | Allyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,35 |           |

- 74 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|--------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 208         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,18 |           |
| 209         | 2-Methoxyethyl   | n-Propyl                       | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,26 |           |
| 210         | i-Butyl  | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,1  |           |
| 211         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>   | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,57 |           |
| 212         | 2-Butyl  | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,09 |           |
| 213         | Cyclopentyl  | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,28 |           |
| 214         | -i-Propyl  | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,75 |           |
| 215         | Cyclopropyl  | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,54 |           |
| 216         | Cyclopropylmethyl  | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,85 |           |
| 217         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,83 |           |
| 218         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,84 |           |
| 219         | 1,3-Dioxolan-2-ylmethyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,62 |           |
| 220         | Allyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,19 |           |
| 221         | i-Butyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,65 |           |
| 222         | 2-Methoxyethyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,64 |           |
| 223         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,57 |           |
| 224         | Allyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,5  |           |
| 225         | 2-Methoxyethyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,94 |           |
| 226         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                  |                                | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,27 |           |
| 227         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                                | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 0,75 |           |
| 228         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -                                 |                                | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 0,75 |           |
| 229         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,92 |           |



- 75 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 230         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,94 |           |
| 231         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -                |                                | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,7  |           |
| 232         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,63 |           |
| 233         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,48 |           |
| 234         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,38 |           |
| 235         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,09 |           |
| 236         | 2-Methoxyethyl   | -H                             | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,3  |           |
| 237         | Propargyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,75 |           |
| 238         | (2-Furyl)methyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,2  |           |
| 239         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,23 |           |
| 240         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,11 |           |
| 241         | n-Butyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,1  |           |
| 242         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,24 |           |
| 243         | Cyclopropylmethyl  | n-Propyl                       | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,07 |           |
| 244         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl  | n-Propyl                       | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,7  |           |
| 245         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                                |                                | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 0,75 |           |
| 246         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,48 |           |
| 247         | n-Butyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,18 |           |
| 248         | i-Butyl  | -H                             | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,14 |           |
| 249         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>   | -H                             | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,59 |           |

- 76 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|-----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 250         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -H                             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,8  |           |
| 251         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                                | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,95 |           |
| 252         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,33 |           |
| 253         | -CH <sub>2</sub> -CN   | -H                             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,11 |           |
| 254         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,55 |           |
| 255         | Cyclopentyl  | -H                             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,29 |           |
| 256         | -i-Propyl  | -H                             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,77 |           |
| 257         | 2-Methoxyethyl   | -H                             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,42 |           |
| 258         | Cyclopropyl  | -H                             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,77 |           |
| 259         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,18 |           |
| 260         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H                             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,77 |           |
| 261         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,72 |           |
| 262         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,99 |           |
| 263         | Cyclopropylmethyl  | -H                             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,95 |           |

- 77 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 264         | 2-Butyl   | -H                             | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,14 |           |
| 265         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -                |                                | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,33 |           |
| 266         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,07 |           |
| 267         | Allyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,59 |           |
| 268         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,29 |           |
| 269         | 2-Methoxyethyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,03 |           |
| 270         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                        | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,14 |           |
| 271         | Propargyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,77 |           |
| 272         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                        | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,48 |           |
| 273         | Allyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,26 |           |
| 274         | (2-Furyl)methyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,26 |           |
| 275         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                     | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,63 |           |
| 276         | i-Butyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,68 |           |
| 277         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl   | n-Propyl                       | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,72 |           |

- 78 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 278         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -   |                  | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,02 |           |
| 279         | 1,3-Dioxolan-2-ylmethyl   | -CH <sub>3</sub> | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             |      |           |
| 280         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                               |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,14 |           |
| 281         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                                   |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,74 |           |
| 282         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                            |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,9  |           |
| 283         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -  |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,11 |           |
| 284         | AB10  |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,68 |           |
| 285         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-              |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,7  |           |
| 286         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -              |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,74 |           |
| 287         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -              |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,75 |           |
| 288         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,01 |           |
| 289         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(COCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -            |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,5  |           |
| 290         | -CH <sub>2</sub> -CH=C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -               |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,94 |           |
| 291         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -                             |                  | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,49 |           |

- 79 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>             | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|----------------|----------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 292         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(COOCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -   |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,78 |           |
| 293         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -      |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,49 |           |
| 294         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(NH-COCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,85 |           |
| 295         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -          |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,32 |           |
| 296         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                         |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,3  |           |
| 297         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                         |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,97 |           |
| 298         | 4-Tolyl   | -H             | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,05 |           |
| 299         | 4-Fluorophenyl  | -H             | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,7  |           |
| 300         | AB13  |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,28 |           |
| 301         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                        | -H             | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,7  |           |
| 302         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -      |                | 2-Chlor-6-<br>Fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,99 |           |
| 303         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                                     |                | 2,6-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,73 |           |
| 304         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                       |                | 2,6-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,02 |           |
| 305         | AB8   |                | 2,6-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,64 |           |

- 80 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|----------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 306         | AB9   |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,18 |           |
| 307         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                            |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,83 |           |
| 308         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -  |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,01 |           |
| 309         | AB10  |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,6  |           |
| 310         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -          |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,08 |           |
| 311         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-              |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,57 |           |
| 312         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -              |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,63 |           |
| 313         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -              |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,64 |           |
| 314         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                            |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,03 |           |
| 315         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,91 |           |
| 316         | -CH <sub>2</sub> -CH=C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -               |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,84 |           |
| 317         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -                             |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,39 |           |
| 318         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(COOCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -           |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,69 |           |
| 319         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHBr-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                              |                | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,33 |           |

- 81 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|------------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 320         | -CH(COOCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -   |                  | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,04 |           |
| 321         | AB12  |                  | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,15 |           |
| 322         | AB11  |                  | 2-Fluorophenyl         | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,26 |           |
| 323         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(NH-COCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                  | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,78 |           |
| 324         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -       |                  | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,12 |           |
| 325         | AB14  |                  | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,56 |           |
| 326         | 3-Tolyl   | -H               | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,89 |           |
| 327         | AB13  |                  | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,22 |           |
| 328         | i-Butyl   | -H               | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,85 |           |
| 329         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | -H               | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,27 |           |
| 330         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                        | -H               | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,55 |           |
| 331         | Propargyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,54 |           |
| 332         | 1,3-Dioxolan-2-ylmethyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,43 |           |
| 333         | Allyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,6-<br>Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,95 |           |

- 82 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|--------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 334         | -CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,55 |           |
| 335         | i-Butyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,37 |           |
| 336         | 2-Methoxyethyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,45 |           |
| 337         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,3  |           |
| 338         | n-Butyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,46 |           |
| 339         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,65 |           |
| 340         | (2-Furyl)methyl                                       | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,28 |           |
| 341         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl                             | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3    |           |
| 342         | 2-Methoxyethyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,74 |           |
| 343         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,85 |           |
| 344         | n-Butyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,82 |           |
| 345         | Cyclopropylmethyl                                     | n-Propyl                       | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,83 |           |
| 346         | (2-Tetrahydropyranyl)methyl                           | n-Propyl                       | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,95 |           |
| 347         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl                             | n-Propyl                       | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,39 |           |



- 83 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|--------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 348         | 2-Methoxyethyl  | n-Propyl                       | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,12 |           |
| 349         | 3-Trifluormethylcyclohexyl  | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,52 |           |
| 350         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,23 |           |
| 351         | Propargyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,67 |           |
| 352         | 2-Methoxyethyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,58 |           |
| 353         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,37 |           |
| 354         | (2-Furyl)methyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,39 |           |
| 355         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,04 |           |
| 356         | Cyclopropylmethyl   | n-Propyl                       | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,91 |           |
| 357         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl   | n-Propyl                       | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,6  |           |
| 358         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,89 |           |
| 359         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl | AS          | 2,95 |           |
| 360         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl | BS          | 2,96 |           |
| 361         | i-Butoxy  | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,98 |           |

- 84 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>       | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 362         | -O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,28 |           |
| 363         | Benzyloxy   | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,93 |           |
| 364         | 3,5-Dichlorbenzyloxy  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,76 |           |
| 365         | 4-Trifluormethylbenzyloxy   | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,43 |           |
| 366         | 2-Chlorbenzyloxy  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,21 |           |
| 367         | 3-Chlorbenzyloxy  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,28 |           |
| 368         | 4-Chlorbenzyloxy  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,3  |           |
| 369         | 4-Fluorbenzyloxy  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,98 |           |
| 370         | -O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>                        | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,87 |           |
| 371         | 3-Trifluormethylbenzyloxy   | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,38 |           |
| 372         | -n-Butoxy   | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,98 |           |
| 373         | Allyloxy  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,42 |           |
| 374         | t-Butoxy  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,75 |           |
| 375         | 2-Hexahydropyranyloxy   | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,59 |           |
| 376         | -O-CH <sub>3</sub>  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,03 |           |
| 377         | -O-CH <sub>3</sub>  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,5  |           |
| 378         | O-i-Propyl  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,54 |           |
| 379         | 1-Cyclopropylethyl  | -H                             | 2,4,6-Trifluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,09 |           |
| 380         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-Trifluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,42 |           |
| 381         | -CH <sub>3</sub>  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,34 |           |
| 382         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,8  |           |
| 383         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | -H                             | 2-Fluorphenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,3  |           |

- 85 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|--------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 384         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,19 |           |
| 385         | Cyclopentyl  | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,11 |           |
| 386         | -i-Propyl  | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,63 |           |
| 387         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,95 |           |
| 388         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,16 |           |
| 389         | -CH <sub>3</sub>   | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,02 |           |
| 390         | Cyclopropyl  | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,41 |           |
| 391         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,53 |           |
| 392         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,37 |           |
| 393         | Cyclopropylmethyl  | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,72 |           |
| 394         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,68 |           |
| 395         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,7  |           |
| 396         | 1-Cyclohexylethyl  | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,16 |           |
| 397         | Cyclohexyl   | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,43 |           |
| 398         | 2-Trifluormethylcyclohexyl   | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,49 |           |
| 399         | 3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl   | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,73 |           |
| 400         | 4-Trifluormethylcyclohexyl   | -H                             | 2-Fluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,48 |           |
| 401         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )- |                                | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,91 |           |
| 402         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                                | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,05 |           |
| 403         | -CH <sub>2</sub> -CN   | -H                             | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,03 |           |
| 404         | (2-Furyl)methyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,56 |           |
| 405         | Cyclopentyl  | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,24 |           |

- 86 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 406         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>                                     | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,68 |           |
| 407         | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -COCH <sub>3</sub> | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,53 |           |
| 408         | 2-Trifluormethylcyclohexyl  | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,56 |           |
| 409         | 4-Trifluormethylcyclohexyl  | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,56 |           |
| 410         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,8  |           |
| 411         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN                                 | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,34 |           |
| 412         | -CH <sub>2</sub> -CN  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,34 |           |
| 413         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN                                 | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,58 |           |
| 414         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | Cyclopropyl                    | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,29 |           |
| 415         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -           |                                | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,95 |           |
| 416         | 2-Methoxyethyl  | n-Propyl                       | 2-Chlorophenyl            | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,36 |           |
| 417         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH <sub>2</sub>                              | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,85 |           |
| 418         | -CH <sub>3</sub>  | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,37 |           |
| 419         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | -H                             | 2,6-<br>Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,31 |           |

- 87 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|----------------|--------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 420         | -CH <sub>2</sub> -CN   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,91 |           |
| 421         | -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,34 |           |
| 422         | -CH <sub>3</sub>   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,03 |           |
| 423         | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,33 |           |
| 424         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,56 |           |
| 425         | 2-Trifluormethylcyclohexyl   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,52 |           |
| 426         | -OH  | -i-Propyl      | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,52 |           |
| 427         | Benzyloxy  | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,93 |           |
| 428         | 3,5-Dichlorbenzyloxy   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,75 |           |
| 429         | 2,4-Dichlorbenzyloxy   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,69 |           |
| 430         | 4-Trifluormethylbenzyloxy  | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,44 |           |
| 431         | 2-Chlorbenzyloxy   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,13 |           |
| 432         | 4-Fluorbenzyloxy   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,9  |           |
| 433         | 3-Trifluormethylbenzyloxy  | -H             | 2,6-Difluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,41 |           |

- 88 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|-----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 434         | -n-Butoxy  | -H                             | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,96 |           |
| 435         | 2,6-Dichlorbenzyloxy   | -H                             | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,31 |           |
| 436         | -O-CH <sub>3</sub>   | -H                             | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,07 |           |
| 437         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlorophenyl        | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,1  |           |
| 438         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlorophenyl        | -CH <sub>3</sub> | F  |             | 2,97 |           |
| 439         | 2-Fluorocyclopropyl  | -H                             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,3  |           |
| 440         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | Cyclopropyl                    | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3    |           |
| 441         | -CH <sub>2</sub> -CH(NH <sub>2</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,19 |           |
| 442         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(COCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,49 |           |
| 443         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,85 |           |
| 444         | 4-Tolyl  | -H                             | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,01 |           |
| 445         | 4-Fluorophenyl   | -H                             | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,71 |           |
| 446         | AB28   |                                | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,34 |           |
| 447         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlorophenyl        | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,59 |           |

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 448         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl  | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 4,49 |           |
| 449         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 4,61 |           |
| 450         | AB8  |                                | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,73 |           |
| 451         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,16 |           |
| 452         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                   |                                | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,2  |           |
| 453         | -CH(COOCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -  |                                | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,36 |           |
| 454         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                                | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,96 |           |
| 455         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -                |                                | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,94 |           |
| 456         | 3-Tolyl  | -H                             | 2,4-<br>Difluorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3    |           |
| 457         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,59 |           |
| 458         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl  | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,58 |           |
| 459         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                       |                                | 2-Chlor-6-<br>Fluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,46 |           |
| 460         | i-Butyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl  | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,69 |           |
| 461         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>   | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl  | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 4,19 |           |

- 90 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>           | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|--------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 462         | 2-Butyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,69 |           |
| 463         | Cyclopentyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,9  |           |
| 464         | -i-Propyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,35 |           |
| 465         | Cyclopropylmethyl  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,43 |           |
| 466         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,34 |           |
| 467         | i-Butyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 4,36 |           |
| 468         | 2-Methoxyethyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,29 |           |
| 469         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 4,27 |           |
| 470         | 2-Methoxyethyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,64 |           |
| 471         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                  |                                | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,9  |           |
| 472         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                                | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,52 |           |
| 473         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 4,66 |           |
| 474         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 4,22 |           |
| 475         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2,4,6-<br>Trifluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |             | 3,02 |           |



| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup> | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|----------------|-----------------------|----------------|----|-------------|------|-----------|
| 476         | i-Butyl  | -H             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,64 |           |
| 477         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                       | -H             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,08 |           |
| 478         | 2-Butyl  | -H             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,66 |           |
| 479         | Cyclopentyl  | -H             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,83 |           |
| 480         | -i-Propyl  | -H             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,33 |           |
| 481         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,19 |           |
| 482         | Cyclopropylmethyl  | -H             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,4  |           |
| 483         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                    | -H             | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,31 |           |
| 484         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -  |                | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,71 |           |
| 485         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -  |                | 2,4,6-Trifluorphenyl  | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,74 |           |
| 486         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -  |                | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,74 |           |
| 487         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4,6-Trifluorphenyl  | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,42 |           |
| 488         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,39 |           |
| 489         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclopropyl    | Cl | AS          | 3,51 |           |

- 92 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|-----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 490         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl | BS          | 3,52 |           |
| 491         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,37 | 96-98     |
| 492         | i-Butyl  | -H                             | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,76 |           |
| 493         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,27 |           |
| 494         | 2-Butyl  | -H                             | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,76 |           |
| 495         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -H                             | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,41 |           |
| 496         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,32 |           |
| 497         | i-Butyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,41 |           |
| 498         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                  |                                | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,99 |           |
| 499         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )- |                                | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,61 |           |
| 500         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H                             | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,22 |           |
| 501         | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                                | 2-Chlorphenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,41 |           |
| 502         | (2,2-Dichlorcyclopropyl)methyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2,4,6-Trifluorphenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,68 |           |
| 503         | -i-Propyl  | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,5  |           |

- 93 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|------------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 504         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                        |                  | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,58 |           |
| 505         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl      | Cl | AS +<br>BS  | 3,75 |           |
| 506         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H               | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,35 |           |
| 507         | (2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,18 | 133-36    |
| 508         | (2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl   | -CH <sub>3</sub> | 2-Chlorophenyl         | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,29 |           |
| 509         | (2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4,6-Trifluorophenyl  | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,26 |           |
| 510         | (2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl   | -CH <sub>3</sub> | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,37 |           |
| 511         | -CH <sub>2</sub> -CH=C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -       |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,59 |           |
| 512         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -                     |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,14 |           |
| 513         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                       |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,45 |           |
| 514         | AB12  |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,78 |           |
| 515         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -      |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,07 |           |
| 516         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(NH-COCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 2,2  |           |
| 517         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -          |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,03 |           |

- 94 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|----------------|-----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 518         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4-Difluorophenyl    | Cyclopropyl      | Cl |             | 2,85 |           |
| 519         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4-Difluorophenyl    | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,58 |           |
| 520         | AB14  |                | 2,4-Difluorophenyl    | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,25 |           |
| 521         | 4-Tolyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl    | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,6  |           |
| 522         | AB13  |                | 2,4-Difluorophenyl    | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,87 |           |
| 523         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H             | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,38 |           |
| 524         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,84 |           |
| 525         | i-Butyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,03 |           |
| 526         | n-Butyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,07 |           |
| 527         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                      | -H             | 2,4-Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,4  |           |
| 528         | 2-Butyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,03 |           |
| 529         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>                      | -H             | 2,4-Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,7  |           |
| 530         | Cyclopentyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,21 |           |
| 531         | Cyclopropyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,49 |           |

- 95 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|------------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 532         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>                                   | -H               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,58 |           |
| 533         | Cyclopropylmethyl   | -H               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,8  |           |
| 534         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>               | -H               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,75 |           |
| 535         | t-Butyl   | -H               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,19 |           |
| 536         | 3-Trifluormethylcyclohexyl  | -H               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,44 |           |
| 537         | 4-Trifluormethylcyclohexyl  | -H               | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,43 |           |
| 538         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -CH <sub>3</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 1,77 |           |
| 539         | Propargyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,65 |           |
| 540         | 1,3-Dioxolan-2-ylmethyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,62 |           |
| 541         | Allyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,09 |           |
| 542         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN                               | -CH <sub>3</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,19 |           |
| 543         | (2-Furyl)methyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,11 |           |
| 544         | i-Butyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,54 |           |
| 545         | 2-Methoxyethyl  | -CH <sub>3</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,73 |           |

- 96 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 546         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>               | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,44 |           |
| 547         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 1,91 |           |
| 548         | Allyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,4  |           |
| 549         | (2-Furyl)methyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,42 |           |
| 550         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN                               | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,46 |           |
| 551         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,05 |           |
| 552         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl   | n-Propyl                       | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,77 |           |
| 553         | 2-Methoxyethyl  | n-Propyl                       | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,39 |           |
| 554         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | Cyclopropyl                    | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,28 |           |
| 555         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -         |                                | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 2,76 |           |
| 556         | Cyclohexyl  | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,47 |           |
| 557         | 1-Cyclohexylethyl   | -H                             | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 5,12 |           |
| 558         | 2-Methoxyethyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-<br>Difluorophenyl    | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,03 |           |
| 559         | AB30  | -H                             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,71 |           |

- 97 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|-----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 560         | n-Butyl   | -H                             | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,89 |           |
| 561         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,28 |           |
| 562         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,62 |           |
| 563         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN                               | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,17 |           |
| 564         | -CH <sub>2</sub> -CN  | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,18 |           |
| 565         | -CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>                                | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,32 |           |
| 566         | (2-Furyl)methyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,97 |           |
| 567         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,46 |           |
| 568         | Allyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,3  |           |
| 569         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN                               | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,41 |           |
| 570         | 2-Thienylmethyl   | n-Propyl                       | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,96 |           |
| 571         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -NH <sub>2</sub>                  | -i-Propyl                      | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 1,28 |           |
| 572         | AB31  |                                | 2,6-Difluorophenyl    | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,66 |           |
| 573         | AB31  |                                | 2,4,6-Trifluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,9  |           |

- 98 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>             | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer   | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|----------------|----------------------------|------------------|----|---------------|------|-----------|
| 574         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 3,07 |           |
| 575         | AB31  |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 2,74 |           |
| 576         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 2,95 |           |
| 577         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H             | 2,4-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |               |      |           |
| 578         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-              |                | 2,6-<br>Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 2,61 |           |
| 579         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H             | 2-Chlorophenyl             | Cyclo-<br>propyl | Cl |               | 4,14 |           |
| 580         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH-CH(CH <sub>3</sub> )-                       |                | 2-Chlorophenyl             | Cyclo-<br>propyl | Cl |               | 4,19 |           |
| 581         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H             | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | Cyclo-<br>propyl | Cl |               | 4,03 |           |
| 582         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH-CH(CH <sub>3</sub> )-                       |                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | Cyclo-<br>propyl | Cl |               | 4,17 |           |
| 583         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H             | 2-Chlor-6-<br>Fluorophenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |               | 4,12 |           |
| 584         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH=CH-CH(CH <sub>3</sub> )-                       |                | 2-Chlor-6-<br>Fluorophenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl |               | 4,15 |           |
| 585         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-              |                | 2,4,6-<br>Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 2,93 |           |
| 586         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H             | 2-Chlor-4-<br>fluorophenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl | AS<br>+<br>BR | 4,25 |           |



- 99 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer   | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|------------------------|------------------|----|---------------|------|-----------|
| 587         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H                             | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl      | Cl | AR<br>+<br>BS | 4,25 |           |
| 588         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H                             | 2-Chlor-4-fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 3,6  |           |
| 589         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlor-4-fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 3,23 |           |
| 590         | AB31  |                                | 2-Chlor-4-fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 2,99 |           |
| 591         | Allyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,96 |           |
| 592         | (2-Furyl)methyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,97 |           |
| 593         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,78 |           |
| 594         | 2-Methoxyethyl  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,46 |           |
| 595         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,54 |           |
| 596         | n-Butyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 4,52 |           |
| 597         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,73 |           |
| 598         | Cyclopropylmethyl   | n-Propyl                       | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 4,53 |           |
| 599         | (2-Tetrahydropyranyl)methyl   | n-Propyl                       | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 4,71 |           |

- 100 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup> | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|----------------|-------------------|----------------|----|-------------|------|-----------|
| 600         | (2-Tetrahydrofuryl)methyl  | n-Propyl       | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,22 |           |
| 601         | 2-Thienylmethyl  | n-Propyl       | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,64 |           |
| 602         | 2-Methoxyethyl   | n-Propyl       | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,84 |           |
| 603         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                                    |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,2  |           |
| 604         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                      |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,76 |           |
| 605         | AB9  |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 1,46 |           |
| 606         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                          |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,36 |           |
| 607         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                   |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,29 |           |
| 608         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=CH-CH <sub>2</sub> -                                     |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,72 |           |
| 609         | AB10   |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,22 |           |
| 610         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> - |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,72 |           |
| 611         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-     |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,3  |           |
| 612         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -     |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,37 |           |
| 613         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                | 2,4-Difluorphenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,41 |           |

- 101 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup> | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|------------------|------------------------|----------------|----|-------------|------|-----------|
| 614         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                            |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,57 |           |
| 615         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                  | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,67 |           |
| 616         | 2-Methoxyethyl  | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,07 |           |
| 617         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-              |                  | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,72 |           |
| 618         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -              |                  | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,82 |           |
| 619         | Dimethylamino   | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,29 |           |
| 620         | 1-Cyclopropylethylamino   | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,81 |           |
| 621         | i-Butyl   | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,9  |           |
| 622         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,37 |           |
| 623         | 2-Butyl   | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,9  |           |
| 624         | Cyclopentyl   | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,13 |           |
| 625         | Cyclopropylmethyl   | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,63 |           |
| 626         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>   | -H               | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,59 |           |
| 627         | i-Butyl   | -CH <sub>3</sub> | 2-Chlor-4-fluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,51 |           |

- 102 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer   | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|-----------------------|------------------|----|---------------|------|-----------|
| 628         | 2-Methoxyethyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 3,46 |           |
| 629         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 4,41 |           |
| 630         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 4,77 |           |
| 631         | 2-Methoxyethyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 3,81 |           |
| 632         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 4,13 |           |
| 633         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-              |                                | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 4,08 |           |
| 634         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                                | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 3,72 |           |
| 635         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 4,37 |           |
| 636         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                |                                | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 3,18 |           |
| 637         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>               | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 4,61 |           |
| 638         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 3,37 |           |
| 639         | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -              |                                | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclo-propyl     | Cl |               | 4,23 |           |
| 640         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl | AS<br>+<br>BS | 3,19 |           |

- 103 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|-----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 641         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl                          | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl | AS          | 3,2  |           |
| 642         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl                          | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl | BS          | 3,17 |           |
| 643         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-4-fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,06 |           |
| 644         | i-Butyl   | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,38 |           |
| 645         | n-Butyl   | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,6  |           |
| 646         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4    |           |
| 647         | 2-Butyl   | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,57 |           |
| 648         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>    | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,25 |           |
| 649         | n-Propyl  | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,2  |           |
| 650         | Cyclopentyl   | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,76 |           |
| 651         | -i-Propyl   | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,2  |           |
| 652         | Cyclohexyl  | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4,02 |           |
| 653         | 1-Cyclohexylethyl                                     | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4,84 |           |
| 654         | 2-Methoxyethyl  | -H                             | 2,4-Difluorphenyl     | Cyclo-propyl     | Cl |             | 2,75 |           |

- 104 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup> | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|------------------|--------------------|----------------|----|-------------|------|-----------|
| 655         | Cyclopropyl  | -H               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,95 |           |
| 656         | Cyclopropylmethyl  | -H               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,26 |           |
| 657         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                    | -H               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,22 |           |
| 658         | 3-Trifluormethylcyclohexyl   | -H               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,98 |           |
| 659         | 4-Trifluormethylcyclohexyl   | -H               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,93 |           |
| 660         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -H               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,24 |           |
| 661         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 1,56 |           |
| 662         | Propargyl  | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,21 |           |
| 663         | 1,3-Dioxolan-2-ylmethyl  | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,1  |           |
| 664         | Allyl  | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,61 |           |
| 665         | 3-(Dimethylamino)-propyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 1,61 |           |
| 666         | -CH <sub>2</sub> -CH(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                     | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,24 |           |
| 667         | (2-Furyl)methyl  | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,63 |           |
| 668         | i-Butyl  | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,07 |           |

- 105 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup> | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|------------------|-----------------------|----------------|----|-------------|------|-----------|
| 669         | 2-Methoxyethyl   | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,16 |           |
| 670         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,05 |           |
| 671         | n-Butyl  | -CH <sub>3</sub> | 2,4-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,21 |           |
| 672         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H               | 2,4,6-Trifluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,25 |           |
| 673         | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                  | 2,4,6-Trifluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,08 |           |
| 674         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )- |                  | 2,4,6-Trifluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,6  |           |
| 675         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                  | 2,4,6-Trifluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,68 |           |
| 676         | i-Butyl  | -CH <sub>3</sub> | 2,6-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,08 |           |
| 677         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -CH <sub>3</sub> | 2,6-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,98 |           |
| 678         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                  |                  | 2,6-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,68 |           |
| 679         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                  | 2,6-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,25 |           |
| 680         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )- |                  | 2,6-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,17 |           |
| 681         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                  | 2,6-Difluorophenyl    | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,34 |           |

- 106 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|----------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 682         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,6-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,9  |           |
| 683         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                |                | 2,6-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 2,78 |           |
| 684         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H             | 2,6-Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,18 |           |
| 685         | -CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                 | -H             | 2,6-Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,56 |           |
| 686         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-            |                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,42 |           |
| 687         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | -H             | 2,4-Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,08 |           |
| 688         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H             | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,43 |           |
| 689         | AB31   |                | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,32 |           |
| 690         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                |                | 2,4-Difluorophenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,56 |           |
| 691         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -               |                | 2-Chlor-4-fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,94 |           |
| 692         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -               |                | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,83 |           |
| 693         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-            |                | 2,4-Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,3  |           |
| 694         | -CH <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>   | -H             | 2,4,6-Trifluorophenyl  | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,41 |           |
| 695         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-                             |                | 2,4-Difluorophenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,79 |           |



| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>         | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|------------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 696         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2-Chlorophenyl         | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,46 |           |
| 697         | -CH <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>   | -H                             | 2-Chlor-4-fluorophenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 2,54 |           |
| 698         | i-Butyl  | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4,32 |           |
| 699         | 2-Methoxyethyl   | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,3  |           |
| 700         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                                      | -CH <sub>3</sub>               | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4,21 |           |
| 701         | 2-Methoxyethyl   | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,66 |           |
| 702         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-                  |                                | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,94 |           |
| 703         | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                                | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4,1  |           |
| 704         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                      |                                | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,55 |           |
| 705         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )- |                                | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4,54 |           |
| 706         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4,59 |           |
| 707         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                                | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,63 |           |
| 708         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                                | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 4,19 |           |
| 709         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                                | 2-Chlor-6-Fluorophenyl | Cyclo-propyl     | Cl |             | 3,05 |           |

- 108 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup> | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|--------------------|----------------|----|-------------|------|-----------|
| 710         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H                             | 2,4-Dichlorophenyl | Cyclopropyl    | Cl | AS          | 4,12 |           |
| 711         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H                             | 2,4-Dichlorophenyl | Cyclopropyl    | Cl | BS          | 4,19 |           |
| 712         | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                      | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,97 |           |
| 713         | -CH <sub>2</sub> -CN  | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,42 |           |
| 714         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>                                   | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,17 |           |
| 715         | 2-Trifluormethylcyclohexyl  | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,08 |           |
| 716         | 3,5-bis-Trifluormethylcyclohexyl                                    | -H                             | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,31 |           |
| 717         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,28 |           |
| 718         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN                               | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,79 |           |
| 719         | -CH <sub>2</sub> -CN  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,79 |           |
| 720         | -CH <sub>2</sub> -COOCH <sub>3</sub>                                | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,95 |           |
| 721         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -Cl                               | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,5  |           |
| 722         | -CH <sub>3</sub>  | -CH <sub>3</sub>               | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,06 |           |
| 723         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 1,65 |           |
| 724         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -NH <sub>2</sub>                  | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 1,47 |           |
| 725         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN                               | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,07 |           |
| 726         | 3-Aminopropyl   | n-Propyl                       | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 1,61 |           |

- 109 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup> | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|----------------|--------------------|----------------|----|-------------|------|-----------|
| 727         | -CH <sub>2</sub> -COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>  | Cyclopropyl    | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,84 |           |
| 728         | AB8   |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 2,17 |           |
| 729         | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                     |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,14 |           |
| 730         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(COCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -  |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,07 |           |
| 731         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(COOCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,38 |           |
| 732         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHBr-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                    |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 4,08 |           |
| 733         | -CH(COOCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,92 |           |
| 734         | AB11  |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 1,55 |           |
| 735         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -     |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 1,43 |           |
| 736         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -               |                | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,63 |           |
| 737         | 3-Tolyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,61 |           |
| 738         | 4-Fluorophenyl  | -H             | 2,4-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,27 |           |
| 739         | -i-Propyl   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,14 |           |
| 740         | Cyclopentyl   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,66 |           |
| 741         | -CH <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>  | -H             | 2,4-Dichlorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,42 |           |
| 742         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>   | -H             | 2,4-Dichlorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,72 |           |
| 743         | AB31  |                | 2,6-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,23 |           |
| 744         | i-Butyl   | -H             | 2,6-Difluorophenyl | Cyclopropyl    | Cl |             | 3,44 |           |

- 110 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>            | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer             | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|---------------------------|------------------|----|-------------------------|------|-----------|
| 745         | (2,2-Dichlorocyclopropyl)methyl  | -H                             | 2-Chlorphenyl             | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 3,78 |           |
| 746         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlor-4-<br>fluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl | AS + BS<br>+ AR +<br>BR |      |           |
| 747         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlor-4-<br>fluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl | AS<br>+<br>BR           | 3,73 |           |
| 748         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlor-4-<br>fluorphenyl | Cyclo-<br>propyl | Cl | AR<br>+<br>BS           | 3,77 |           |
| 749         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2,4-<br>Dichlorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 4,72 |           |
| 750         | -NH <sub>2</sub>   | i-Butyl                        | 2,4-<br>Dichlorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 4,36 |           |
| 751         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2,6-<br>Difluorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 3,82 |           |
| 752         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                    | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,6-<br>Difluorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 4,31 |           |
| 753         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -  |                                | 2,6-<br>Difluorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 3,47 |           |
| 754         | -NH <sub>2</sub>   | i-Butyl                        | 2,6-<br>Difluorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 3,47 |           |
| 755         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4-<br>Dichlorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 4,02 | 208-9     |
| 756         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2,4-<br>Dichlorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl | AR                      | 4,72 |           |
| 757         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2,4-<br>Dichlorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl | BR                      | 4,72 |           |
| 758         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2,4-<br>Dichlorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl | AS                      | 4,72 |           |
| 759         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2,4-<br>Dichlorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl | BS                      | 4,72 |           |
| 760         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                    | -H                             | 2,6-<br>Difluorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 3,28 |           |
| 761         | 2-Butyl  | -H                             | 2,6-<br>Difluorphenyl     | Cyclo-<br>propyl | Cl |                         | 3,44 |           |

- 111 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer   | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|--------------------------------|-----------------------|------------------|----|---------------|------|-----------|
| 762         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                       | -H                             | 2,6-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,9  |           |
| 763         | -CH <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>                                       | -H                             | 2,6-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 2,72 |           |
| 764         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2,6-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,98 |           |
| 765         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -O-               |                                | 2,6-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,26 |           |
| 766         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |               | 2,8  |           |
| 767         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl | AS            | 3,73 |           |
| 768         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl   | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl | BS            | 3,77 |           |
| 769         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                    | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Dichlorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 5,25 |           |
| 770         | AB32   |                                | 2,6-Difluorphenyl     | Cyclo-l          | Cl |               | 3,32 |           |
| 771         | -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>  | -H                             | 2,6-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,04 |           |
| 772         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,6-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,19 |           |
| 773         | -NH <sub>2</sub>   | i-Butyl                        | 2,4,6-Trifluorphenyl  | Cyclopropyl      | Cl |               | 3,65 | 186-8     |
| 774         | AB33   | -H                             | 2,4-Dichlorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |               | 2,7  |           |
| 775         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl | AR<br>+<br>BR | 4,23 |           |
| 776         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl | BR            | 4,25 |           |
| 777         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl | AR            | 4,23 |           |
| 778         | 1,2-Dimethylpropyl   | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl | AS            | 4,23 |           |

- 112 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup>                 | R <sup>3</sup>        | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|--------------------------------|-----------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 779         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H                             | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl | BS          | 4,23 |           |
| 780         | AB31  |                                | 2,4-Dichlorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,41 |           |
| 781         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H                             | 2,4-Dichlorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl | AS          | 3,55 | 210-1     |
| 782         | 2,2,2-Trifluor-1-methylethyl  | -H                             | 2,4-Dichlorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl | BS          | 3,58 | 216-7     |
| 783         | -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>                     | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 2,4-Dichlorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,56 |           |
| 784         | -NH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -  |                                | 2,4-Dichlorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,35 |           |
| 785         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -   |                                | 2-Chlor-4-fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,87 |           |
| 786         | AB32  |                                | 2,4,6-Trifluorphenyl  | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,56 |           |
| 787         | 1-Methylethylidenamino  | i-Butyl                        | 2,6-Difluorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,21 |           |
| 788         | 1,2-Dimethylpropyl  | -H                             | 2,4-Dichlorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 4,06 | 132-35    |
| 789         | i-Butyl   | -H                             | 2,4-Dichlorphenyl     | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,68 |           |
| 790         | i-Butyl   | -H                             | 2,4-Dichlorphenyl     | Cyclopropyl      | Cl |             | 4,3  |           |
| 791         | -NH <sub>2</sub>  | i-Butyl                        | 2-Chlor-6-Fluorphenyl | Cyclopropyl      | Cl |             | 3,74 | 175-6     |
| 792         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )- |                                | 2,4-Difluorphenyl     | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,27 |           |
| 793         | AB8   |                                | 2,4-Difluorphenyl     | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 2,56 |           |
| 794         | -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                                | 2,4-Difluorphenyl     | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,44 |           |
| 795         | AB9   |                                | 2,4-Difluorphenyl     | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 1,67 |           |

- 113 -

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>     | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|---|----------------|--------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 796         | AB10  |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,8  |           |
| 797         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -          |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 5,18 |           |
| 798         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -              |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,8  |           |
| 799         | -CH <sub>2</sub> -CH(OH)-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                            |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,07 |           |
| 800         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> - |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 5,03 |           |
| 801         | -CH <sub>2</sub> -CH=C(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -               |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,95 |           |
| 802         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH=C(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -                             |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,55 |           |
| 803         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(COOCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -           |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,81 |           |
| 804         | -CH(COOCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -           |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,32 |           |
| 805         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(CF <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -              |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,43 |           |
| 806         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH(NH-COCH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -         |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 2,71 |           |
| 807         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -               |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 1,65 |           |
| 808         | -CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -                         |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,1  |           |
| 809         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                  |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,45 |           |
| 810         | -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -                                 |                | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,04 |           |
| 811         | 2-Tolyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,99 |           |
| 812         | 3-Tolyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,04 |           |
| 813         | 4-Tolyl   | -H             | 2,4-Difluorophenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,08 |           |

| Bsp.<br>Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>    | R <sup>4</sup>   | X  | Iso-<br>mer | logP | Fp.: (°C) |
|-------------|--|----------------|-------------------|------------------|----|-------------|------|-----------|
| 814         | 4-Fluorphenyl  | -H             | 2,4-Difluorphenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 3,69 |           |
| 815         | AB13   |                | 2,4-Difluorphenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,35 |           |
| 816         | -NH <sub>2</sub>   | i-Butyl        | 2,4-Dichlorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,71 |           |
| 817         | -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -  |                | 2,4-Dichlorphenyl | -CH <sub>3</sub> | Cl |             | 3,67 |           |
| 818         | -CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | -H             | 2,4-Difluorphenyl | -CF <sub>3</sub> | Cl |             | 4,73 |           |

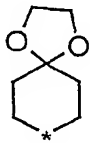
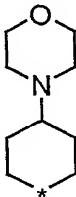
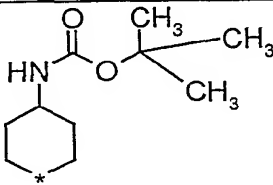
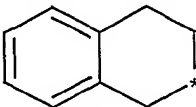
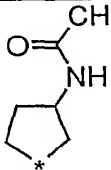
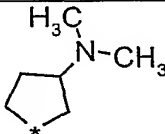
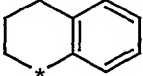
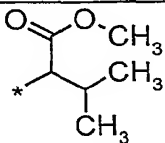
Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

5      \*) bedeutet, dass R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen heterocyclischen Ring bilden.

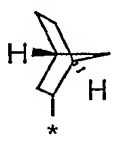
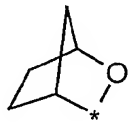
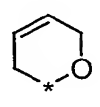
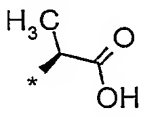
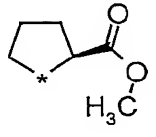
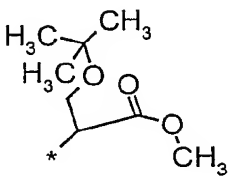
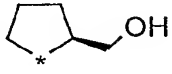
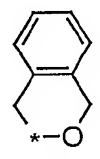
10      \*\*) Die Produkte wurden teilweise als Stereoisomere isoliert. "S", bzw. "R" bedeutet S- bzw. R-Konfiguration am Chiralitätszentrum; "AS" bedeutet eine eindeutige aber unbekannte Konfiguration am Atropiezentrum und S-Konfiguration am Chiralitätszentrum. BS bedeutet die jeweils andere eindeutige aber unbekannte Konfiguration am Atropiezentrum und S-Konfiguration am Chiralitätszentrum. "AR" und "BR" bedeuten wiederum die jeweiligen komplementären Konfigurationen am Atropiezentrum gepaart mit der R-Konfiguration am Chiralitätszentrum. Demnach sind bei  
15      gleichen Substituenten "AR" und "BS", sowie "AS" und "BR" jeweils Enantiomerenpaare.



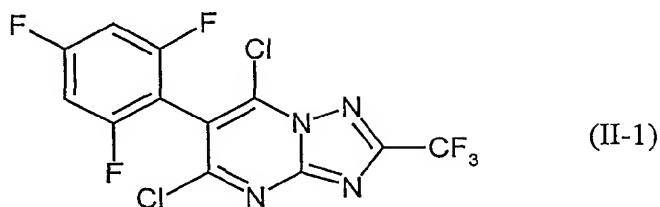
- 115 -

|      |   |
|------|---|
| AB10 |    |
| AB11 |    |
| AB12 |    |
| AB14 |   |
| AB8  |  |
| AB9  |  |
| AB28 |  |
| AB3  |  |

- 116 -

|      |   |
|------|---|
| AB30 |    |
| AB31 |    |
| AB32 |    |
| AB33 |    |
| AB4  |   |
| AB5  |  |
| AB6  |  |
| AB7  |  |

\* markiert jeweils die Bindungsstelle

Herstellung von AusgangsstoffenBeispiel 819

5

2,6 g (7,43 mMol) 2-Trifluormethyl-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]-pyrimidin-5,7-diol werden bei Raumtemperatur in 20 ml Phosphoroxychlorid gelöst, portionsweise mit 1,2 g Phosphorpentachlorid versetzt und anschließend 6 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Flüchtige Bestandteile der Reaktionsmischung werden unter vermindertem Druck abdestilliert. Der Rückstand wird mit 20 ml Wasser versetzt und mit 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und an Kieselgel mit Dichlormethan chromatografiert. Man erhält 1,2 g (37,6 % der Theorie) 5,7-Dichlor-2-(trifluormethyl)-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin.

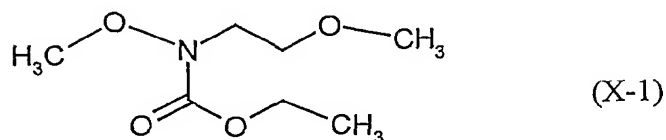
15

HPLC: logP = 3,71

Beispiel 820

20

Verfahren (e), erste Stufe:

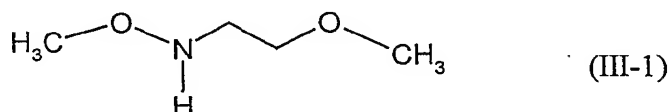


- 118 -

1 000 mg N-Methoxy-carbaminsäureethylester werden in 10,0 ml Dimethylformamid vorgelegt und portionsweise mit 403 mg Natriumhydrid versetzt, wobei die Temperatur durch Kühlung auf 30°C eingestellt wurde. Die Reaktionsmischung wird für 2 Stunden bei 30°C gerührt und anschließend mit 3 500 mg 2-Bromethyl-methylether versetzt. Die Reaktionsmischung wird für 18 Stunden bei 20°C bis 25°C gerührt und anschließend in 20 ml Wasser eingerührt. Die erhaltene Reaktionsmischung wird unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt und viermal mit je 30 ml Dichlormethan extrahiert. Die organischen Extrakte werden über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt.

Man erhält 1 200 mg (N-Methoxy-N-methoxyethyl)carbaminsäure-ethylester (Reinheit 77,6 %, Ausbeute 62,6 %).

Verfahren (e), zweite Stufe:



200 mg (N-Methoxy-N-methoxyethyl)-carbaminsäureethylester werden in 4,0 ml wässrigem Ethanol (59 %ig) vorgelegt, mit 240,6 mg Kaliumhydroxid versetzt und für 18 Stunden bei 40°C gerührt. Die Reaktionsmischung wird dann in 50 ml Wasser eingerührt, dreimal mit je 20 ml Diethylether und dreimal mit je 20 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit je 20 ml Wasser gewaschen, getrocknet und bei 20°C unter vermindertem Druck auf ein Volumen von 20 ml eingeengt.

Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit 2 ml Salzsäure versetzt, 1 Stunde bei Raumtemperatur gerührt und bei 20°C unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt.

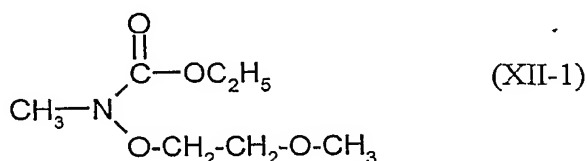
- 119 -

Das erhaltene Produkt wird dreimal mit je 15 ml Methanol digeriert und anschließend bei 20°C unter vermindertem Druck zur Trockne eingeengt.

Man erhält 140 mg N-Methoxy-N-methoxyethylamin-hydrochlorid (Ausbeute 87,6 %).

### Beispiel 821

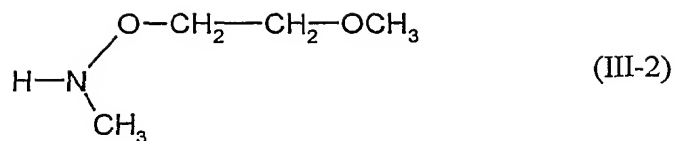
Verfahren (f), erste Stufe:



Ein Gemisch aus 1000 mg N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester, 1166 mg 2-Bromethyl-methylether und Rühren auf Rückflusstemperatur erhitzt und dann tropfenweise mit einer Lösung von 493 mg Kaliumhydroxid in 5 ml Ethanol versetzt. Man kocht das Reaktionsgemisch 10 Stunden unter Rückfluss und arbeitet dann auf, indem man das Reaktionsgemisch filtriert und das Filtrat unter vermindertem Druck einengt. Der verbleibende Rückstand wird mit einem Gemisch aus Wasser und Essigsäureethylester versetzt. Die organische Phase wird abgetrennt, mit gesättigter, wässriger Ammoniumchlorid-Lösung und dann mit Wasser gewaschen. Anschließend wird die organische Phase über Natriumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck eingeengt. Man erhält auf diese Weise 0,7 g eines Produktes, das gemäß Gaschromatogramm zu 83 % aus (N-Methyl-N-methoxyethoxy)-carbaminsäure-ethylester besteht. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 39 % der Theorie.

Verfahren (f), zweite Stufe:

- 120 -

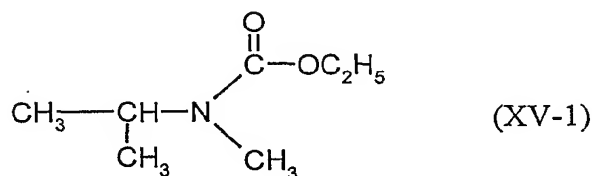


Ein Gemisch aus 200 mg (N-Methyl-N-methoxyethoxy)-carbaminsäure-ethylester, 4 ml Ethanol und 4 ml Wasser wird mit 240,6 mg pulverisiertem Kaliumhydroxid  
 5 versetzt und 2 Stunden bei 40°C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird danach in 50 ml Wasser eingerührt, dann dreimal mit je 20 ml Diethylether und anschließend dreimal mit je 20 ml Methylenchlorid extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden zweimal mit je 20 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und bei Raumtemperatur unter vermindertem Druck auf ein Volumen von 20 ml einge-  
 10engt. Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit 1 ml etherischer Salzsäure versetzt. Die sich abscheidenden Kristalle werden abfiltriert und getrocknet. Man erhält auf diese Weise 190 mg an N-Methyl-N-methoxyethoxy-amin-hydrochlorid.

### Beispiel 822

15

Verfahren (g), erste Stufe:



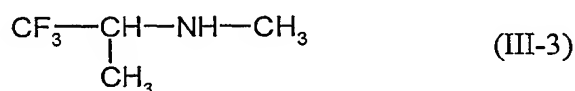
20 Ein Gemisch aus 2000 mg N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-carbaminsäure-ethyl-ester und 20 ml Tetrahydrofuran wird bei Raumtemperatur unter Rühren mit 475 mg Natriumhydrid versetzt. Danach wird unter Rühren bei Raumtemperatur eine Lösung von 4600 mg Iodmethan in 10 ml Tetrahydrofuran hinzuge tropft. Das Reaktions-  
 25gemisch wird 16 Stunden bei 50°C gerührt und dann mit Wasser versetzt. Man extrahiert dreimal mit je 20 ml Methylenchlorid, trocknet die vereinigten organischen

- 121 -

Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck ein. Man erhält 1000 mg eines Produktes, das gemäß Gaschromatogramm zu 75 % aus N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methyl-carbaminsäure-ethylester besteht. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 34,86 %.

5

Verfahren (g), zweite Stufe:

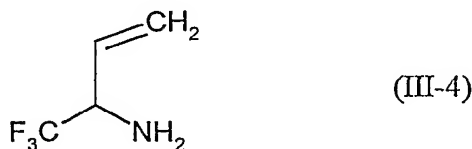


- 10 Ein Gemisch aus 1000 mg N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methyl-carbaminsäure-ethylester, 20 ml Ethanol und 20 ml Wasser wird mit 1070 mg pulverisiertem Kaliumhydroxid versetzt und 66 Stunden bei 40°C gerührt. Danach wird das Reaktionsgemisch mit Wasser verdünnt und dreimal mit je 20 ml eines Gemisches
- 15 extrahiert, das zu gleichen Teilen aus Methylenchlorid und Diethylether besteht. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und dann bei Raumtemperatur unter leicht vermindertem Druck eingeeengt. Die erhaltene Lösung wird unter Eiskühlung mit etherischer Salzsäure versetzt und 60 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Nach dem Einengen unter vermindertem Druck erhält man
- 20 280 mg an N-(2,2,2-Trifluor-1-methyl-ethyl)-N-methylamin-hydrochlorid. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 34 % der Theorie.

### Beispiel 823

Verfahren (h):

25



- 122 -

600 mg N(1-Trifluormethyl-2-propen)-carbaminsäurebenzylester werden in 8,0 ml 16 %iger Salzsäure für 1,5 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Nach dem Abkühlen auf 20°C wird zweimal mit je 20 ml Diethylether extrahiert.

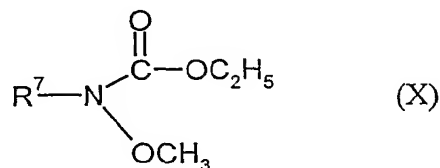
- 5 Die verbleibende wässrige Phase wird unter vermindertem Druck zur Trockne eingengt und dreimal mit je 10 ml Methanol versetzt. Nach Entfernen des Methanols unter vermindertem Druck werden 310 mg an (1-Trifluormethyl-prop-2-en)-amin-hydrochlorid isoliert. Die Ausbeute errechnet sich danach zu 82,9 % der Theorie.

10

Nach den zuvor angegebenen Methoden lassen sich auch die in den folgenden Tabellen angegebenen Carbamate herstellen.

Tabelle 2

15

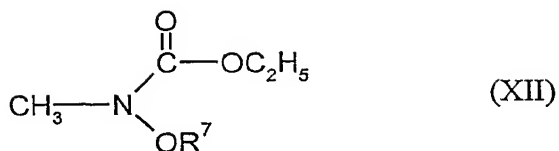


| Beispiel-Nr. | Verb.-Nr. | R <sup>7</sup>  | logP |
|--------------|-----------|---|------|
| 824          | X-2       | $\begin{array}{c} \text{CH}_3-\text{CH}-\text{CH}_2- \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$ | 2,38 |
| 825          | X-3       | $\begin{array}{c} \text{CH}_2=\text{C}-\text{CH}_2- \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$  | 2,06 |



- 123 -

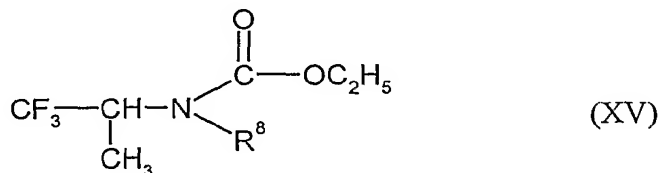
Tabelle 3



| Beispiel-Nr. | Verb.-Nr. | R <sup>7</sup>   | Physikalische Konst. |
|--------------|-----------|--|----------------------|
| 826          | XII-2     | $\begin{array}{c} \text{CH}_2=\text{C}-\text{CH}_2- \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$ |                      |

5

Tabelle 4

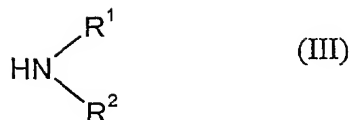


| Beispiel-Nr. | Verb.-Nr. | R <sup>8</sup>                 | Physikalische Konst.   |
|--------------|-----------|--------------------------------|--|
| 827          | XV-2      | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | <sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CD <sub>3</sub> CN):<br>δ (ppm) = 1,13 (t, <u>CH</u> <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> N), 1,21 (t, <u>CH</u> <sub>3</sub> CHCF <sub>3</sub> ), 1,23 (t, <u>CH</u> <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O), 3,20 (m, <u>CH</u> <sub>2</sub> N, <u>CH</u> CF <sub>3</sub> ), 4,1 (q, CH <sub>3</sub> <u>CH</u> <sub>2</sub> O). |

10

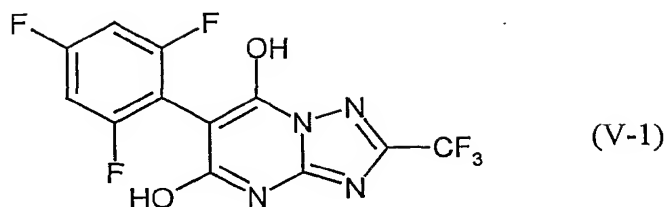
Nach den zuvor angegebenen Methoden lassen sich auch die in der folgenden Tabelle aufgeführten Amine herstellen.

Tabelle 5



| Beispiel-Nr. | Verb.-Nr. | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                 | Physikal. Konst.   |
|--------------|-----------|--|--------------------------------|--|
| 828          | III-5     | $\begin{array}{c} \text{CH}_3 - \text{CH} - \text{CH}_2 - \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$ | -OCH <sub>3</sub>              | <sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, CD <sub>3</sub> CN):<br>δ (ppm) = 1,03 (d, <u>CH</u> <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH),<br>3,06 (d, <u>CH</u> <sub>2</sub> ), 3,28 (b,<br>(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> <u>CH</u> ), 4,01 (s, OCH <sub>3</sub> )  |
| 829          | III-6     | $\begin{array}{c} \text{CH}_2 = \text{C} - \text{CH}_2 - \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$  | -OCH <sub>3</sub>              | <sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, DMSO):<br>δ (ppm) = 1,76 (s,<br><u>CH</u> <sub>3</sub> (CCH <sub>2</sub> )CH <sub>2</sub> ), 3,29 (b, NH,<br>CH <sub>3</sub> (CCH <sub>2</sub> ) <u>CH</u> <sub>2</sub> , OCH <sub>3</sub> ), 7,89,<br>5,02 (2 s, CH <sub>3</sub> (CCH <sub>2</sub> )CH <sub>2</sub> ). |
| 830          | III-7     | $\begin{array}{c} \text{CH}_2 = \text{C} - \text{CH}_2 - \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$  |                                |  |
| 831          | III-8     | $\begin{array}{c} \text{CF}_3 - \text{CH} - \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$               | -C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | <sup>1</sup> H-NMR (400 MHz, DMSO):<br>δ (ppm) = 1,06 (m, <u>CH</u> <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> N,<br><u>CH</u> <sub>3</sub> CHCF <sub>3</sub> ), 3,20 (m, <u>CH</u> <sub>2</sub> N),<br>4,1 (m, <u>CH</u> CF <sub>3</sub> ).   |

- 5 Die in den Beispielen 828 bis 831 aufgeführten Amine wurden jeweils in Form ihrer Hydrochloride isoliert und charakterisiert.

Beispiel 832

- 5      10,1 g (38,5 mmol) 2-(2,4,6-trifluor-phenyl)malonsäuredimethylester und 5,85 g  
(38,5 mmol) 5-Trifluormethyl-1H-[1,2,4]triazol-3-ylamin werden in 10,1 ml Tri-n-  
Butylamin 6 Stunden auf 180°C erhitzt, wobei entstehendes Methanol abdestilliert  
wird. Das Tri-n-Butylamin wird unter stark vermindertem Druck abdestilliert. Man  
erhält 17,8 g rohes 2-Trifluormethyl-6-(2,4,6-trifluor-phenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]-  
10      pyrimidin-5,7-diol, das ohne Reinigung weiter umgesetzt wird.

HPLC: logP = 0,81

Beispiel A

## Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

- 5      Lösungsmittel:      25 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid  
Emulgator:              0,6 Gewichtsteile Alkylarylpolglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1  
Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator  
und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der  
Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach  
Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension  
von Puccinia recondita besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und  
100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20      Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C  
und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von  
Rostpusteln zu begünstigen.

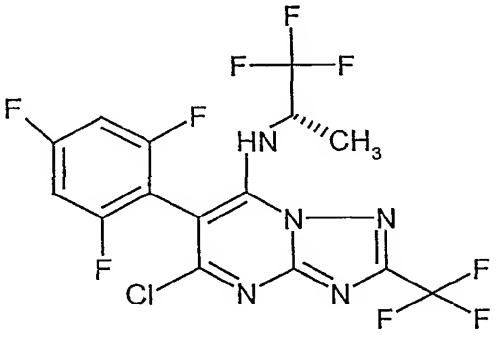
25      10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein  
Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad  
von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden  
Tabelle hervor.

- 127 -

Tabelle A

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

| Wirkstoff  | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad<br>in % |
|--|--------------------------------------|----------------------|
| <div>Erfindungsgemäß</div> <div>Chiral</div> <div><br/>(3)</div> | 500                                  | 100                  |

Beispiel B

Podospaera-Test (Apfel) / protektiv

- 5      Lösungsmittel:      24,5 Gewichtsteile Aceton  
                                 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid  
         Emulgator:      1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

- 10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1  
Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator  
und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 15      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der  
Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach  
Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen  
Sporensuspension des Apfelmehltauerreegers *Podospaera leucotricha* inokuliert.  
Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen  
Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

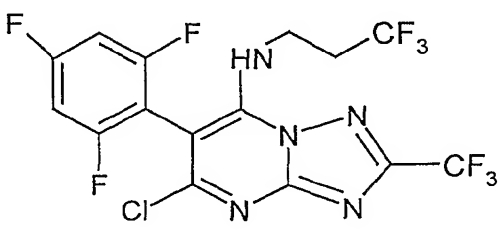
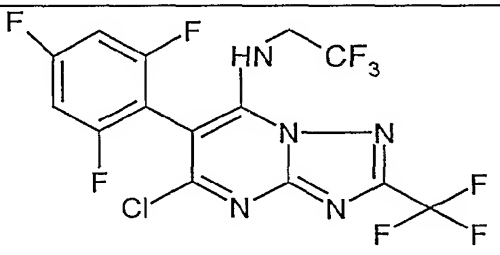
- 20      10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein  
Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad  
von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

- 25      Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden  
Tabelle hervor.

- 129 -

Tabelle B

Podospaera-Test (Apfel) / protektiv

| Wirkstoff   | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad<br>in % |
|---|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß<br><br>(7) | 100                                  | 100                  |
| <br>(8)                  | 100                                  | 100                  |

Beispiel C

Spaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

- 5      Lösungsmittel:      49 Gewichtsteile N,N-Dimethylformamid  
Emulgator:              1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1  
Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator  
und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der  
Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der  
Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Sphaerotheca*  
*fuliginea* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei  
70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

20      7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein  
Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad  
von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

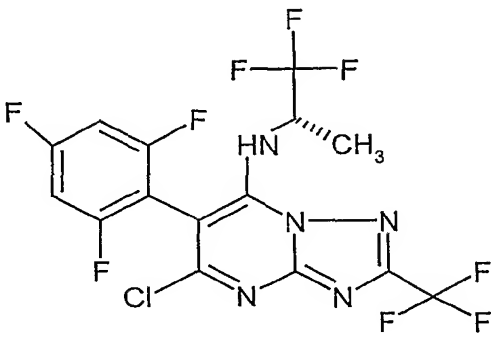
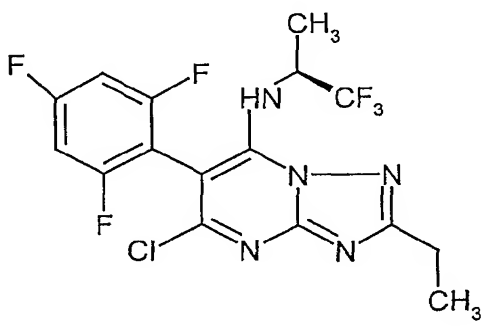
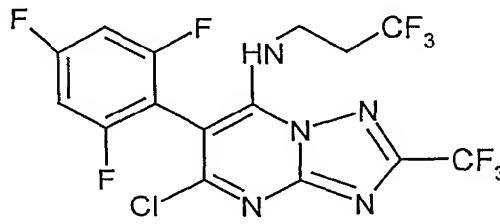
Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden  
Tabelle hervor.



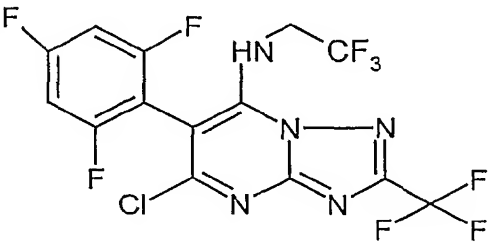
- 131 -

Tabelle C

Spaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

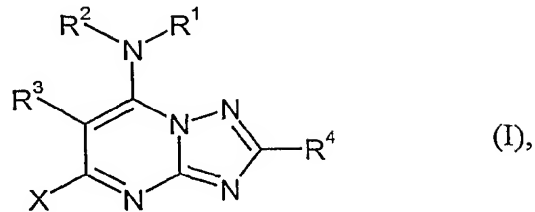
| Wirkstoff   | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad<br>in % |
|---|--------------------------------------|----------------------|
| Erfindungsgemäß:<br><div style="text-align: right;">Chiral</div>  <div style="text-align: right;">(3)</div> | 750                                  | 93                   |
|  <div style="text-align: right;">(4)</div>   | 750                                  | 93                   |
|  <div style="text-align: right;">(7)</div>   | 750                                  | 100                  |

- 132 -

| Wirkstoff  | Aufwandmenge an<br>Wirkstoff in g/ha | Wirkungsgrad<br>in % |
|--|--------------------------------------|----------------------|
| <br>(8) | 750                                  | 100                  |

Patentansprüche

## 1. Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

R<sup>1</sup> für Amino, Hydroxy, für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes Alkenyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkinyloxy, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyloxy, gegebenenfalls substituiertes Alkylamino, gegebenenfalls substituiertes Dialkylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkenylamino, gegebenenfalls substituiertes Alkynylamino, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkylamino, gegebenenfalls substituiertes N-Cycloalkyl-N-alkyl-amino, gegebenenfalls substituiertes Alkylidenamino, gegebenenfalls substituiertes Phenyl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl oder für einen Rest der Formel -S-R<sup>5</sup> steht, worin

R<sup>5</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

- 134 -

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl oder gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht,

5 oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen,

10 R<sup>3</sup> für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

R<sup>4</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl steht und

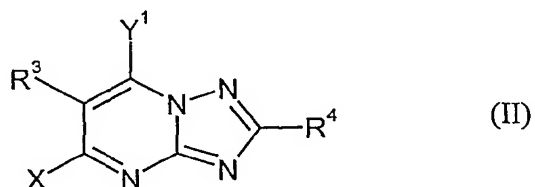
15 X für Halogen steht,

sowie Säure-Additionssalze von denjenigen Verbindungen der Formel (I), in denen

20 R<sup>1</sup> für Amino steht.

2. Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

25 a) Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



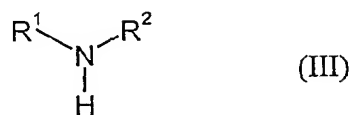
- 135 -

in welcher

$R^3$ ,  $R^4$  und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5  $Y^1$  für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



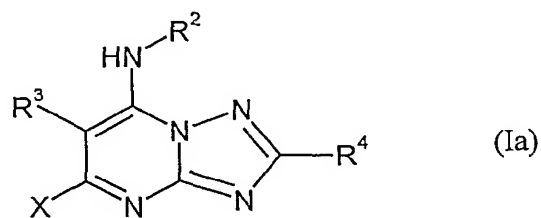
10 in welcher

$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegeben-  
 15 enfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt,

oder

20 b) Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und X die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

- 136 -

mit Sulfensäurehalogeniden der Formel



in welcher

5

$R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und

$Y^2$  für Halogen steht,

10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors umsetzt,

und gegebenenfalls an die so erhaltenen Verbindungen der Formel (I), in denen

15

$R^1$  für Amino steht,

eine Säure addiert.

20

3. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. an einem Säureadditions-Salz davon neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

25

4. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. von deren Säureadditions-Salzen zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

30

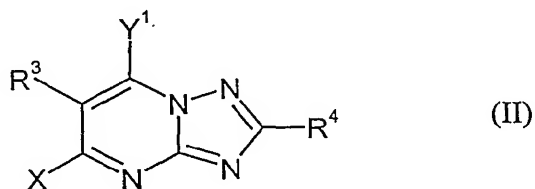
5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch

- 137 -

1 bzw. deren Säureadditions-Salze auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

- 5 6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 bzw. deren Säureadditions-Salze mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

7. Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel



10

in welcher

$R^3$ ,  $R^4$  und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

15

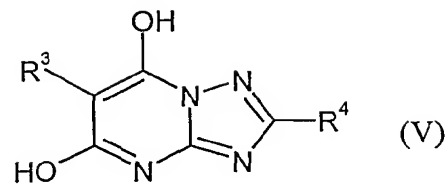
$Y^1$  für Halogen steht.

8. Verfahren zur Herstellung von Dihalogen-triazolopyrimidinen der Formel (II) gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass man

20

(c) Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel

- 138 -



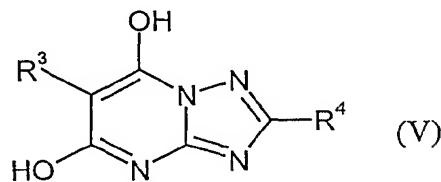
in welcher

R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

9. Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel



10

in welcher

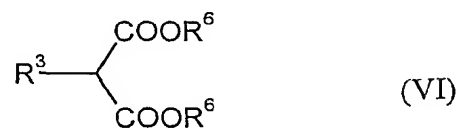
R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben.

10. Verfahren zur Herstellung von Dihydroxy-triazolopyrimidinen der Formel (V)

15

gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, dass man

d) Arylmalonester der Formel



20

in welcher

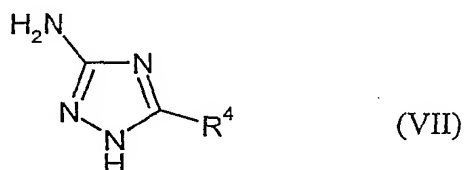


- 139 -

$R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und

$R^6$  für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

5 mit Aminotriazolen der Formel

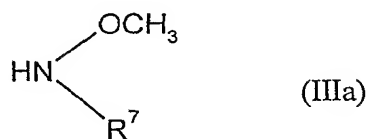


in welcher

10  $R^4$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt.

15 11. Amine der Formel (IIIa),



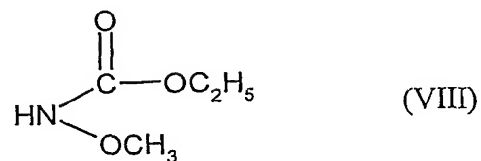
in welcher

20  $R^7$  für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für  $\text{—CH}_2\text{—C(CH}_3\text{)=CH}_2$  steht.

12. Verfahren zur Herstellung von Aminen der Formel (IIIa) gemäß Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, dass man

- 140 -

- e) in einer ersten Stufe N-Methoxycarbaminsäure-ethylester der Formel (VIII)



5 mit Halogenverbindungen der Formel (IX),



in welcher

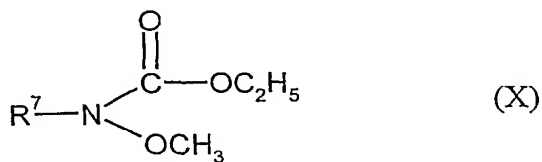
10

$\text{R}^7$  die oben angegebenen Bedeutungen hat und

$\text{X}^1$  für Brom oder Iod steht,

15

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (X),



in welcher

20

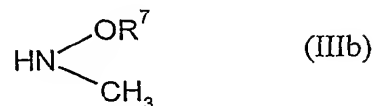
$\text{R}^7$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

25

- 141 -

13. Amine der Formel (IIIb),



5

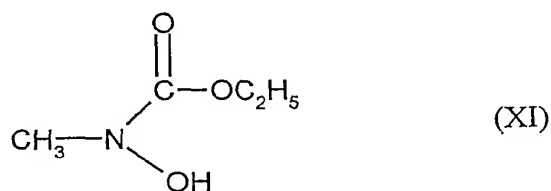
in welcher

$\text{R}^7$  für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für  $\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---C=CH}_2 \\ | \\ \text{CH}_3 \end{array}$  steht.

14. Verfahren zur Herstellung von Aminen der Formel (IIIb) gemäß Anspruch 13, dadurch gekennzeichnet, dass man

10

f) in einer ersten Stufe N-Hydroxy-N-methyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XI)



15

mit Halogenverbindungen der Formel (IX),



in welcher

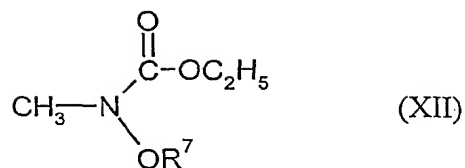
20

$\text{R}^7$  und  $\text{X}^1$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (XII),

25

- 142 -



in welcher

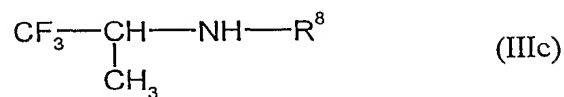
$\text{R}^7$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

5

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol und Wasser umgesetzt.

15. Trifluorisopropylamine der Formel (IIIc),

10



in welcher

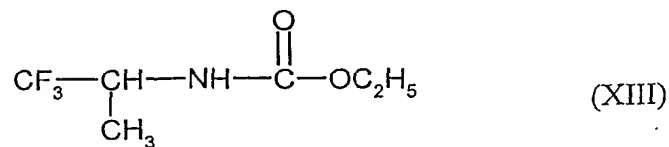
$\text{R}^8$  für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

15

16. Verfahren zur Herstellung von Trifluorisopropylaminen der Formel (IIIc) gemäß Anspruch 15, dadurch gekennzeichnet, dass man

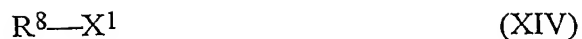
20

g) in einer ersten Stufe N-Trifluorisopropyl-carbaminsäure-ethylester der Formel (XIII)



mit Halogenverbindungen der Formel (XIV),

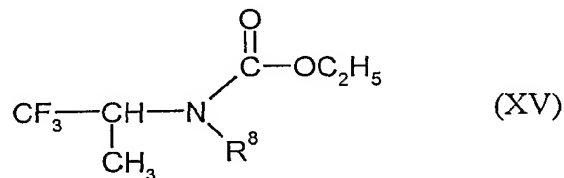
- 143 -



in welcher

5  $R^8$  und  $X^1$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels  
umsetzt und die entstehenden Carbamate der Formel (XV),



10

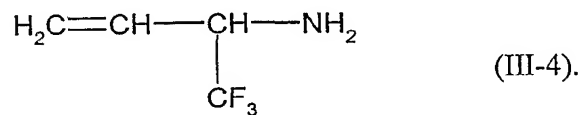
in welcher

$R^8$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

15

in einer zweiten Stufe mit Kaliumhydroxid in Gegenwart von Ethanol  
und Wasser umsetzt.

17. 3-Trifluor-methyl-3-amino-propen der Formel (III-4)



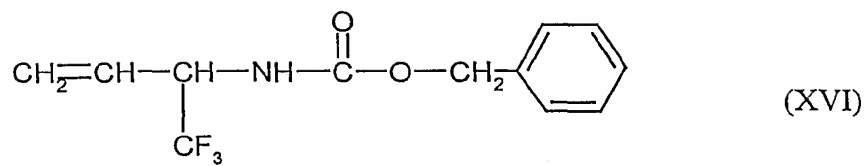
20

18. Verfahren zur Herstellung von 3-Trifluormethyl-3-amino-propen der Formel  
(III-4) gemäß Anspruch 17, dadurch gekennzeichnet, dass man

25

h) das Carbatat der Formel (XVI)

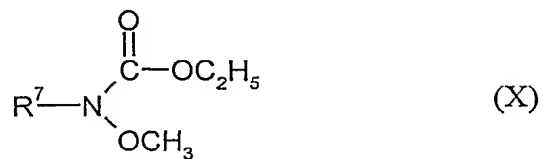
- 144 -



mit wässriger Salzsäure umgesetzt.

- 145 -

19. Carbamate der Formel (X),

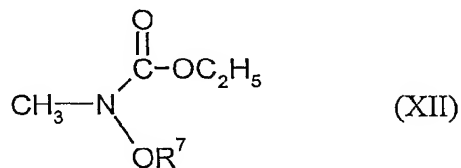


in welcher

5

$\text{R}^7$  für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für  $\text{---CH}_2\text{---}\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}\text{=CH}_2$  steht.

20. Carbamate der Formel (XII),

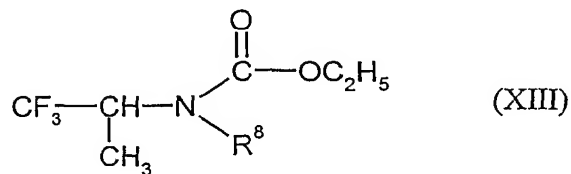


10

in welcher

$\text{R}^7$  für Isobutyl, 2-Methoxyethyl oder für  $\text{---CH}_2\text{---}\underset{\text{CH}_3}{\text{C}}\text{=CH}_2$  steht.

15 21. Carbamate der Formel (XIII),



in welcher

20  $\text{R}^8$  für Methyl, Ethyl oder Propyl steht.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 02/04287

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
 IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
|------------|---|-----------------------|
| X          | EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>8 April 1998 (1998-04-08)<br>claim 1   | 1-21                  |
| Y          | WERMUTH ET AL: "The Practise of Medicinal Chemistry", PRACTICE OF MEDICINAL CHEMISTRY, XX, XX, PAGE(S) 203-237<br>XP002190259<br>the whole document | 1-21                  |
| Y          | EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH)<br>7 July 1993 (1993-07-07)<br>claim 1  | 1-21                  |
| Y          | EP 0 613 900 A (SHELL INT RESEARCH)<br>7 September 1994 (1994-09-07)<br>claim 1   | 1-21                  |
|            | ---<br>-/--   |                       |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \* & \* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 August 2002

Date of mailing of the international search report

03/09/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Baston, E



## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 02/04287

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| Y          | FR 2 784 991 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>28 April 2000 (2000-04-28)<br>claim 1<br>---  | 1-21                  |
| Y          | FR 2 765 875 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>15 January 1999 (1999-01-15)<br>claim 1<br>---  | 1-21                  |
| Y          | GB 2 355 261 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>18 April 2001 (2001-04-18)<br>claim 1<br>---  | 1-21                  |
| Y          | WO 98 46607 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>22 October 1998 (1998-10-22)<br>claim 1<br>---   | 1-21                  |
| Y          | WO 98 46608 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>22 October 1998 (1998-10-22)<br>claim 1<br>---   | 1-21                  |
| A          | US 5 612 345 A (BECHER HEINZ-MANFRED ET AL)<br>18 March 1997 (1997-03-18)<br>claim 1<br>---  | 7,8                   |
| A          | US 5 854 252 A (PEES KLAUS-JURGEN ET AL)<br>29 December 1998 (1998-12-29)<br>claim 1<br>---  | 7,8                   |
| A          | WO 00 09508 A (BAYER AGROCHEM KK ; SAWADA HARUKO (JP); ISHIKAWA KOICHI (JP); KINBA)<br>24 February 2000 (2000-02-24)<br>claim 1<br>----- | 7,8                   |

3

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/04287

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| EP 0834513                                | A | 08-04-1998          | US 5817663 A               | 06-10-1998          |
|   |   |                     | AT 221069 T                | 15-08-2002          |
|   |   |                     | EP 0834513 A2              | 08-04-1998          |
|   |   |                     | JP 10152489 A              | 09-06-1998          |
|   |   |                     | US 5965561 A               | 12-10-1999          |
| EP 0550113                                | A | 07-07-1993          | EP 0550113 A2              | 07-07-1993          |
|   |   |                     | EP 0782997 A2              | 09-07-1997          |
|   |   |                     | GR 3033916 T3              | 30-11-2000          |
|   |   |                     | AT 159256 T                | 15-11-1997          |
|   |   |                     | AT 192154 T                | 15-05-2000          |
|   |   |                     | AU 667204 B2               | 14-03-1996          |
|   |   |                     | AU 3043592 A               | 01-07-1993          |
|   |   |                     | BR 9205172 A               | 06-07-1993          |
|   |   |                     | CA 2086404 A1              | 01-07-1993          |
|   |   |                     | CN 1075144 A ,B            | 11-08-1993          |
|   |   |                     | CN 1141119 A ,B            | 29-01-1997          |
|   |   |                     | DE 69222746 D1             | 20-11-1997          |
|   |   |                     | DE 69222746 T2             | 12-02-1998          |
|   |   |                     | DE 69230977 D1             | 31-05-2000          |
|   |   |                     | DE 69230977 T2             | 09-11-2000          |
|   |   |                     | DK 550113 T3               | 09-02-1998          |
|   |   |                     | DK 782997 T3               | 07-08-2000          |
|   |   |                     | ES 2108727 T3              | 01-01-1998          |
|   |   |                     | ES 2147411 T3              | 01-09-2000          |
|   |   |                     | GR 3025920 T3              | 30-04-1998          |
|   |   |                     | HK 1010105 A1              | 23-06-2000          |
|   |   |                     | HU 217349 B                | 28-01-2000          |
|   |   |                     | IL 104244 A                | 13-07-1997          |
|   |   |                     | JP 5271234 A               | 19-10-1993          |
|   |   |                     | NZ 245581 A                | 26-07-1995          |
|   |   |                     | PL 297160 A1               | 06-09-1993          |
|   |   |                     | PL 171579 B1               | 30-05-1997          |
|   |   |                     | PT 782997 T                | 29-09-2000          |
|   |   |                     | RU 2089552 C1              | 10-09-1997          |
|   |   |                     | SG 47563 A1                | 17-04-1998          |
|   |   |                     | US 5593996 A               | 14-01-1997          |
|   |   |                     | ZA 9210043 A               | 28-07-1993          |
| EP 0613900                                | A | 07-09-1994          | EP 0613900 A1              | 07-09-1994          |
|   |   |                     | AT 153025 T                | 15-05-1997          |
|   |   |                     | AU 672267 B2               | 26-09-1996          |
|   |   |                     | AU 5633294 A               | 08-09-1994          |
|   |   |                     | BG 61647 B1                | 27-02-1998          |
|   |   |                     | BG 98637 A                 | 31-01-1995          |
|   |   |                     | BR 9400808 A               | 01-11-1994          |
|   |   |                     | CA 2116946 A1              | 05-09-1994          |
|   |   |                     | CN 1094407 A               | 02-11-1994          |
|   |   |                     | DE 69403119 D1             | 19-06-1997          |
|   |   |                     | DE 69403119 T2             | 28-08-1997          |
|   |   |                     | DK 613900 T3               | 23-06-1997          |
|   |   |                     | ES 2101429 T3              | 01-07-1997          |
|   |   |                     | GR 3023587 T3              | 29-08-1997          |
|   |   |                     | HK 1001054 A1              | 22-05-1998          |
|   |   |                     | HU 68050 A2                | 29-05-1995          |
|   |   |                     | IL 108731 A                | 18-03-1997          |
|   |   |                     | JP 7002861 A               | 06-01-1995          |
|   |   |                     | NZ 250955 A                | 27-04-1995          |

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/04287

| Patent document<br>cited in search report | Publication<br>date | Patent family<br>member(s)  | Publication<br>date  |
|---|---------------------|---|--|
| EP 0613900                                | A                   | OA 9891 A<br>RO 112869 B1<br>RU 2126408 C1<br>SG 48897 A1<br>US 5756509 A<br>ZA 9401484 A | 15-09-1994<br>30-01-1998<br>20-02-1999<br>18-05-1998<br>26-05-1998<br>10-11-1994   |
| FR 2784991                                | A                   | 28-04-2000  | FR 2784991 A1 28-04-2000   |
| FR 2765875                                | A                   | 15-01-1999  | FR 2765875 A1 15-01-1999<br>JP 11035581 A 09-02-1999   |
| GB 2355261                                | A                   | 18-04-2001  | NONE   |
| WO 9846607                                | A                   | 22-10-1998  | AT 202779 T 15-07-2001<br>AU 6576898 A 11-11-1998<br>DE 69801048 D1 09-08-2001<br>DE 69801048 T2 14-03-2002<br>DK 975634 T3 24-09-2001<br>EP 0975634 A1 02-02-2000<br>ES 2160408 T3 01-11-2001<br>PT 975634 T 28-12-2001<br>WO 9846607 A1 22-10-1998<br>ZA 9803055 A 11-10-1999  |
| WO 9846608                                | A                   | 22-10-1998  | AU 735730 B2 12-07-2001<br>AU 6867198 A 11-11-1998<br>BG 103805 A 30-06-2000<br>BR 9808531 A 23-05-2000<br>CN 1257502 T 21-06-2000<br>EE 9900486 A 15-06-2000<br>EP 0975635 A1 02-02-2000<br>HU 0001993 A2 28-10-2000<br>JP 2001520650 T 30-10-2001<br>NO 994973 A 13-10-1999<br>NZ 500143 A 29-06-2001<br>PL 336164 A1 05-06-2000<br>SK 141499 A3 11-09-2001<br>TR 9902552 T2 22-05-2000<br>TW 460476 B 21-10-2001<br>WO 9846608 A1 22-10-1998<br>ZA 9803054 A 11-10-1999 |
| US 5612345                                | A                   | 18-03-1997  | NONE   |
| US 5854252                                | A                   | 29-12-1998  | AT 159722 T 15-11-1997<br>AU 690899 B2 07-05-1998<br>AU 6258094 A 26-09-1994<br>BR 9405988 A 26-12-1995<br>CA 2157293 A1 15-09-1994<br>CN 1119015 A ,B 20-03-1996<br>CZ 9502233 A3 17-01-1996<br>DE 69406538 D1 04-12-1997<br>DK 699200 T3 20-07-1998<br>WO 9420501 A1 15-09-1994<br>EP 0699200 A1 06-03-1996<br>HK 1004332 A1 20-11-1998<br>HU 73163 A2 28-06-1996  |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/04287

| Patent document<br>cited in search report | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| US 5854252                                | A                   | IL 108747 A                | 12-03-1999          |
|   |                     | JP 8507505 T               | 13-08-1996          |
|   |                     | NZ 262729 A                | 26-01-1996          |
|   |                     | PL 310467 A1               | 11-12-1995          |
|   |                     | RU 2130459 C1              | 20-05-1999          |
|   |                     | SG 48860 A1                | 18-05-1998          |
|   |                     | SK 106895 A3               | 05-06-1996          |
|   |                     | ZA 9401485 A               | 10-11-1994          |
| WO 0009508                                | A                   | JP 2000119274 A            | 25-04-2000          |
|   | 24-02-2000          | AU 5061099 A               | 06-03-2000          |
|   |                     | WO 0009508 A1              | 24-02-2000          |

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile   | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| X          | EP 0 834 513 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>8. April 1998 (1998-04-08)<br>Anspruch 1<br>---   | 1-21               |
| Y          | WERMUTH ET AL: "The Practise of Medicinal Chemistry", PRACTICE OF MEDICINAL CHEMISTRY, XX, XX, PAGE(S) 203-237<br>XP002190259<br>das ganze Dokument<br>--- | 1-21               |
| Y          | EP 0 550 113 A (SHELL INT RESEARCH)<br>7. Juli 1993 (1993-07-07)<br>Anspruch 1<br>---  | 1-21               |
| Y          | EP 0 613 900 A (SHELL INT RESEARCH)<br>7. September 1994 (1994-09-07)<br>Anspruch 1<br>---   | 1-21               |
|            | ---<br>-/--  |                    |

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

27. August 2002

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

03/09/2002

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Baston, E

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Beitr. Anspruch Nr. |
|------------|---|---------------------|
| Y          | FR 2 784 991 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>28. April 2000 (2000-04-28)<br>Anspruch 1<br>---   | 1-21                |
| Y          | FR 2 765 875 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>15. Januar 1999 (1999-01-15)<br>Anspruch 1<br>---  | 1-21                |
| Y          | GB 2 355 261 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>18. April 2001 (2001-04-18)<br>Anspruch 1<br>---   | 1-21                |
| Y          | WO 98 46607 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>22. Oktober 1998 (1998-10-22)<br>Anspruch 1<br>---  | 1-21                |
| Y          | WO 98 46608 A (AMERICAN CYANAMID CO)<br>22. Oktober 1998 (1998-10-22)<br>Anspruch 1<br>---  | 1-21                |
| A          | US 5 612 345 A (BECHER HEINZ-MANFRED ET AL)<br>18. März 1997 (1997-03-18)<br>Anspruch 1<br>---  | 7,8                 |
| A          | US 5 854 252 A (PEES KLAUS-JURGEN ET AL)<br>29. Dezember 1998 (1998-12-29)<br>Anspruch 1<br>---   | 7,8                 |
| A          | WO 00 09508 A (BAYER AGROCHEM KK ; SAWADA HARUKO (JP); ISHIKAWA KOICHI (JP); KINBA)<br>24. Februar 2000 (2000-02-24)<br>Anspruch 1<br>----- | 7,8                 |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/04287

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| EP 0834513 A                                       | 08-04-1998                    | US 5817663 A                      | 06-10-1998                    |
|  |                               | AT 221069 T                       | 15-08-2002                    |
|  |                               | EP 0834513 A2                     | 08-04-1998                    |
|  |                               | JP 10152489 A                     | 09-06-1998                    |
|  |                               | US 5965561 A                      | 12-10-1999                    |
| EP 0550113 A                                       | 07-07-1993                    | EP 0550113 A2                     | 07-07-1993                    |
|  |                               | EP 0782997 A2                     | 09-07-1997                    |
|  |                               | GR 3033916 T3                     | 30-11-2000                    |
|  |                               | AT 159256 T                       | 15-11-1997                    |
|  |                               | AT 192154 T                       | 15-05-2000                    |
|  |                               | AU 667204 B2                      | 14-03-1996                    |
|  |                               | AU 3043592 A                      | 01-07-1993                    |
|  |                               | BR 9205172 A                      | 06-07-1993                    |
|  |                               | CA 2086404 A1                     | 01-07-1993                    |
|  |                               | CN 1075144 A , B                  | 11-08-1993                    |
|  |                               | CN 1141119 A , B                  | 29-01-1997                    |
|  |                               | DE 69222746 D1                    | 20-11-1997                    |
|  |                               | DE 69222746 T2                    | 12-02-1998                    |
|  |                               | DE 69230977 D1                    | 31-05-2000                    |
|  |                               | DE 69230977 T2                    | 09-11-2000                    |
|  |                               | DK 550113 T3                      | 09-02-1998                    |
|  |                               | DK 782997 T3                      | 07-08-2000                    |
|  |                               | ES 2108727 T3                     | 01-01-1998                    |
|  |                               | ES 2147411 T3                     | 01-09-2000                    |
|  |                               | GR 3025920 T3                     | 30-04-1998                    |
|  |                               | HK 1010105 A1                     | 23-06-2000                    |
|  |                               | HU 217349 B                       | 28-01-2000                    |
|  |                               | IL 104244 A                       | 13-07-1997                    |
|  |                               | JP 5271234 A                      | 19-10-1993                    |
|  |                               | NZ 245581 A                       | 26-07-1995                    |
|  |                               | PL 297160 A1                      | 06-09-1993                    |
|  |                               | PL 171579 B1                      | 30-05-1997                    |
|  |                               | PT 782997 T                       | 29-09-2000                    |
|  |                               | RU 2089552 C1                     | 10-09-1997                    |
|  |                               | SG 47563 A1                       | 17-04-1998                    |
|  |                               | US 5593996 A                      | 14-01-1997                    |
|  |                               | ZA 9210043 A                      | 28-07-1993                    |
| EP 0613900 A                                       | 07-09-1994                    | EP 0613900 A1                     | 07-09-1994                    |
|  |                               | AT 153025 T                       | 15-05-1997                    |
|  |                               | AU 672267 B2                      | 26-09-1996                    |
|  |                               | AU 5633294 A                      | 08-09-1994                    |
|  |                               | BG 61647 B1                       | 27-02-1998                    |
|  |                               | BG 98637 A                        | 31-01-1995                    |
|  |                               | BR 9400808 A                      | 01-11-1994                    |
|  |                               | CA 2116946 A1                     | 05-09-1994                    |
|  |                               | CN 1094407 A                      | 02-11-1994                    |
|  |                               | DE 69403119 D1                    | 19-06-1997                    |
|  |                               | DE 69403119 T2                    | 28-08-1997                    |
|  |                               | DK 613900 T3                      | 23-06-1997                    |
|  |                               | ES 2101429 T3                     | 01-07-1997                    |
|  |                               | GR 3023587 T3                     | 29-08-1997                    |
|  |                               | HK 1001054 A1                     | 22-05-1998                    |
|  |                               | HU 68050 A2                       | 29-05-1995                    |
|  |                               | IL 108731 A                       | 18-03-1997                    |
|  |                               | JP 7002861 A                      | 06-01-1995                    |
|  |                               | NZ 250955 A                       | 27-04-1995                    |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/04287

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| EP 0613900 A                                       |                               | OA 9891 A                         | 15-09-1994                    |
|  |                               | RO 112869 B1                      | 30-01-1998                    |
|  |                               | RU 2126408 C1                     | 20-02-1999                    |
|  |                               | SG 48897 A1                       | 18-05-1998                    |
|  |                               | US 5756509 A                      | 26-05-1998                    |
|  |                               | ZA 9401484 A                      | 10-11-1994                    |
| FR 2784991 A                                       | 28-04-2000                    | FR 2784991 A1                     | 28-04-2000                    |
| FR 2765875 A                                       | 15-01-1999                    | FR 2765875 A1                     | 15-01-1999                    |
|  |                               | JP 11035581 A                     | 09-02-1999                    |
| GB 2355261 A                                       | 18-04-2001                    | KEINE                             |                               |
| WO 9846607 A                                       | 22-10-1998                    | AT 202779 T                       | 15-07-2001                    |
|  |                               | AU 6576898 A                      | 11-11-1998                    |
|  |                               | DE 69801048 D1                    | 09-08-2001                    |
|  |                               | DE 69801048 T2                    | 14-03-2002                    |
|  |                               | DK 975634 T3                      | 24-09-2001                    |
|  |                               | EP 0975634 A1                     | 02-02-2000                    |
|  |                               | ES 2160408 T3                     | 01-11-2001                    |
|  |                               | PT 975634 T                       | 28-12-2001                    |
|  |                               | WO 9846607 A1                     | 22-10-1998                    |
|  |                               | ZA 9803055 A                      | 11-10-1999                    |
| WO 9846608 A                                       | 22-10-1998                    | AU 735730 B2                      | 12-07-2001                    |
|  |                               | AU 6867198 A                      | 11-11-1998                    |
|  |                               | BG 103805 A                       | 30-06-2000                    |
|  |                               | BR 9808531 A                      | 23-05-2000                    |
|  |                               | CN 1257502 T                      | 21-06-2000                    |
|  |                               | EE 9900486 A                      | 15-06-2000                    |
|  |                               | EP 0975635 A1                     | 02-02-2000                    |
|  |                               | HU 0001993 A2                     | 28-10-2000                    |
|  |                               | JP 2001520650 T                   | 30-10-2001                    |
|  |                               | NO 994973 A                       | 13-10-1999                    |
|  |                               | NZ 500143 A                       | 29-06-2001                    |
|  |                               | PL 336164 A1                      | 05-06-2000                    |
|  |                               | SK 141499 A3                      | 11-09-2001                    |
|  |                               | TR 9902552 T2                     | 22-05-2000                    |
|  |                               | TW 460476 B                       | 21-10-2001                    |
|  |                               | WO 9846608 A1                     | 22-10-1998                    |
|  |                               | ZA 9803054 A                      | 11-10-1999                    |
| US 5612345 A                                       | 18-03-1997                    | KEINE                             |                               |
| US 5854252 A                                       | 29-12-1998                    | AT 159722 T                       | 15-11-1997                    |
|  |                               | AU 690899 B2                      | 07-05-1998                    |
|  |                               | AU 6258094 A                      | 26-09-1994                    |
|  |                               | BR 9405988 A                      | 26-12-1995                    |
|  |                               | CA 2157293 A1                     | 15-09-1994                    |
|  |                               | CN 1119015 A ,B                   | 20-03-1996                    |
|  |                               | CZ 9502233 A3                     | 17-01-1996                    |
|  |                               | DE 69406538 D1                    | 04-12-1997                    |
|  |                               | DK 699200 T3                      | 20-07-1998                    |
|  |                               | WO 9420501 A1                     | 15-09-1994                    |
|  |                               | EP 0699200 A1                     | 06-03-1996                    |
|  |                               | HK 1004332 A1                     | 20-11-1998                    |
|  |                               | HU 73163 A2                       | 28-06-1996                    |



# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/04287

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| US 5854252   | A                             | IL 108747 A                       | 12-03-1999                    |
|  |                               | JP 8507505 T                      | 13-08-1996                    |
|  |                               | NZ 262729 A                       | 26-01-1996                    |
|  |                               | PL 310467 A1                      | 11-12-1995                    |
|  |                               | RU 2130459 C1                     | 20-05-1999                    |
|  |                               | SG 48860 A1                       | 18-05-1998                    |
|  |                               | SK 106895 A3                      | 05-06-1996                    |
|  |                               | ZA 9401485 A                      | 10-11-1994                    |
| WO 0009508   | A                             | JP 2000119274 A                   | 25-04-2000                    |
|  |                               | AU 5061099 A                      | 06-03-2000                    |
|  |                               | WO 0009508 A1                     | 24-02-2000                    |